

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 10 月 13 日 (13.10.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/095380 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 401/04, A01N 43/40,
43/46, C07D 405/14, 413/14, 451/06

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/006887

(22) 国際出願日: 2005 年 3 月 30 日 (30.03.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-106668 2004 年 3 月 31 日 (31.03.2004) JP
特願 2004-374007
2004 年 12 月 24 日 (24.12.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本
曹達株式会社 (NIPPON SODA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
100-8165 東京都千代田区大手町二丁目2番1号
Tokyo (JP).

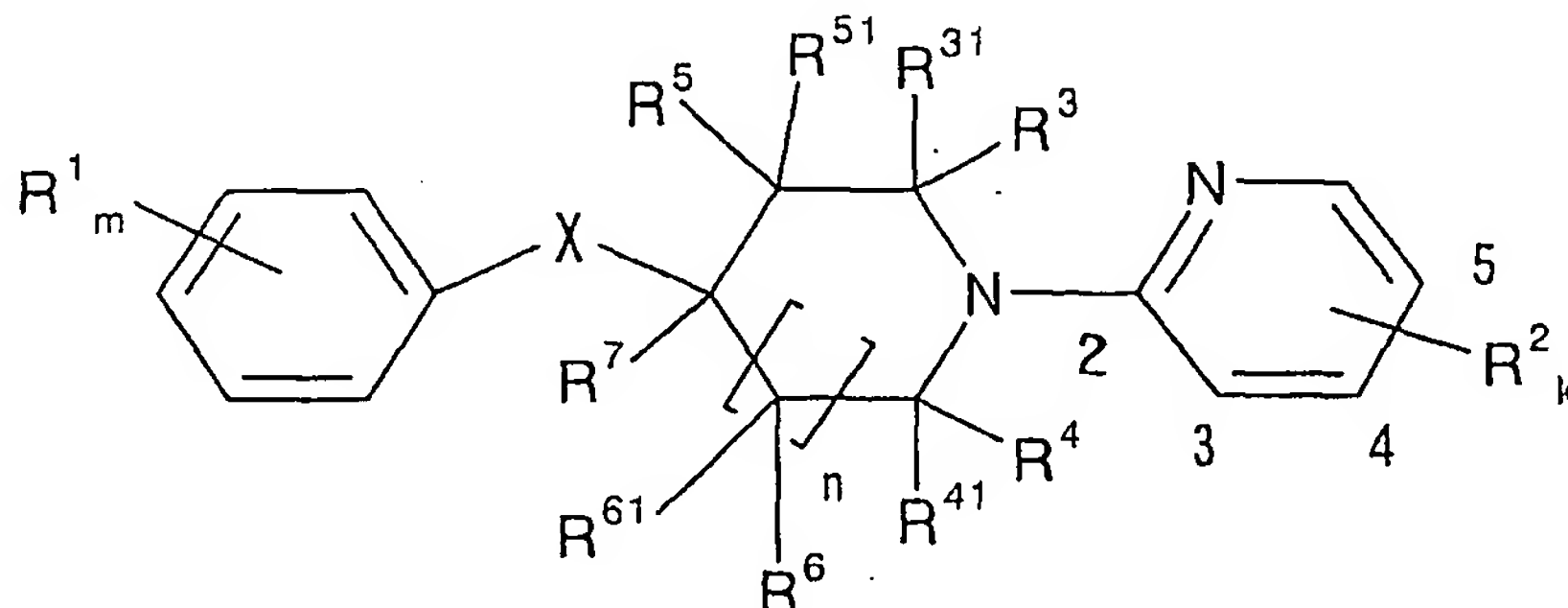
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 浜本 伊佐美
(HAMAMOTO, Isami) [JP/JP]; 〒250-0280 神奈川県小
田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所
内 Kanagawa (JP). 高橋 淳 (TAKAHASHI, Jun) [JP/JP];
〒250-0280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 矢野 真樹
郎 (YANO, Makio) [JP/JP]; 〒250-0280 神奈川県小田
原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所
内 Kanagawa (JP). 花井 大輔 (HANAI, Daisuke) [JP/JP];
〒250-0280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達
株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 岩佐 孝男
(IWASA, Takao) [JP/JP]; 〒250-0280 神奈川県小田原
市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内
Kanagawa (JP).(74) 代理人: 志賀 正武, 外 (SHIGA, Masatake et al.); 〒
104-8453 東京都中央区八重洲2丁目3番1号 Tokyo
(JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,

[続葉有]

(54) Title: CYCLIC AMINE COMPOUND AND PEST CONTROL AGENT

(54) 発明の名称: 環状アミン化合物および有害生物防除剤





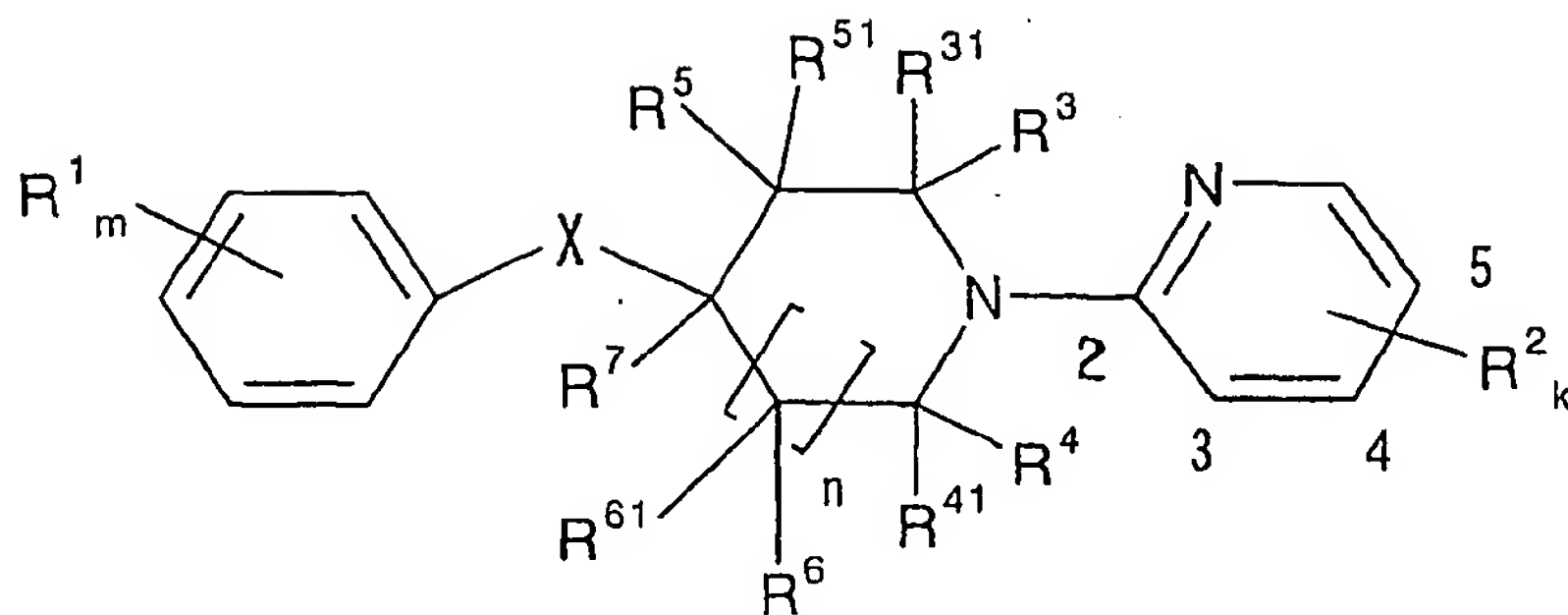
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類：
— 国際調査報告書

(57) 要約:

式[I]



[I]

[式中、 R^1 は、水酸基等、 m は0または1～5の整数を示し、 R^2 は、ハロゲン原子等、 k は0または1～4の整数を示し、 R^3 、 R^{31} 、 R^4 、 R^{41} 、 R^5 、 R^{51} 、 R^6 、 R^{61} および R^7 は、それぞれ独立して水素原子等を示し、 X は、酸素原子等を示し、 n は0または1を示す。]

で表される化合物、式[I]で表される化合物の塩、N-酸化物および式[I]を有効成分として含有する有害生物防除剤。

明細書

環状アミン化合物および有害生物防除剤

技術分野

本発明は、新規な環状アミン化合物およびそれらを有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

本願は、2004年3月31日に出願された日本国特許出願第2004-106668号及び2004年12月24日に出願された日本国特許出願第2004-374007号に対し優先権を主張し、その内容をここに援用する。

背景技術

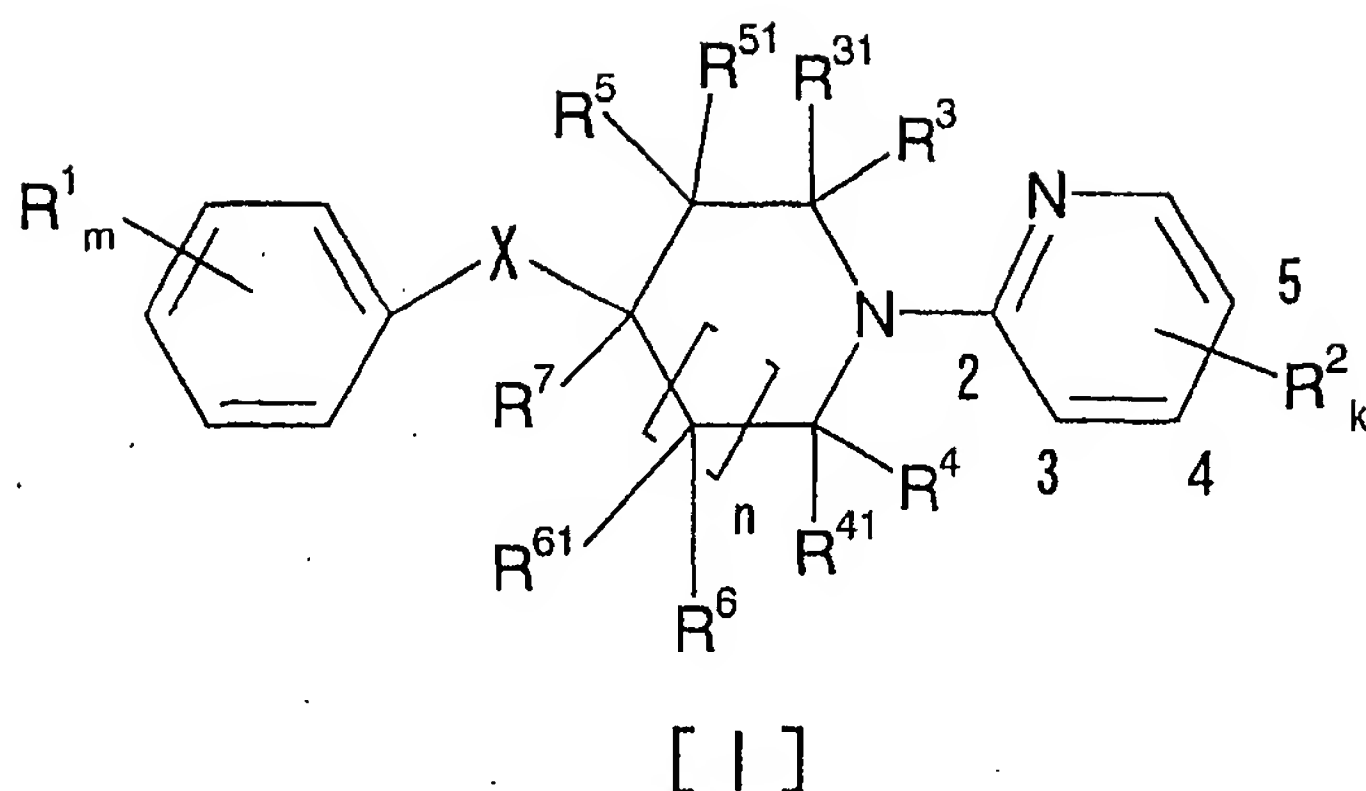
従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

本発明化合物と類似した骨格を有する化合物が、欧州特許出願公報第0605031号明細書に抗ウィルス剤として記載されているが、殺虫、殺ダニ活性を有する旨は記載されてなく、本発明化合物の合成および生物活性についてはこれまで報告されていなかった。

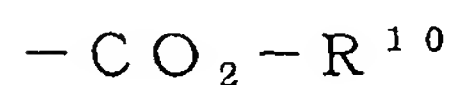
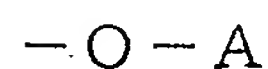
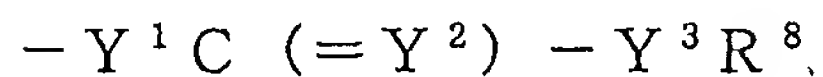
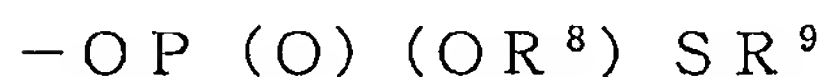
発明の開示

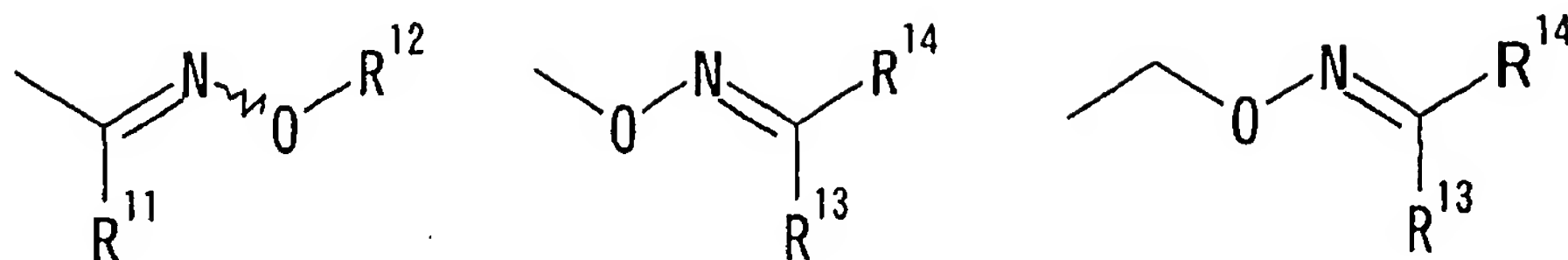
本発明は、工業的に有利に合成でき効果が確実に安全に使用できる有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

即ち本発明は、式[I]



[式中、 R^1 は、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、 G^1 で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{1-6} ハロアルケニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 G^2 で置換されてもよい C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} ハロアルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルチオカルボニルオキシ基、 G^3 で置換されてもよいアミノ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} ハロアルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニルオキシ基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニルオキシ基、 G^4 で置換されてもよい（酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の）複素環基、または下記式





[式中、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立して C_{1-6} アルキル基を示し、 Y^1 、 Y^2 および Y^3 はそれぞれ独立して酸素原子または硫黄原子を示し、 A は G^4 で置換されてもよい（酸素原子および窒素原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の）複素環基を示し、 R^{10} は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{1-6} アルキル C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、または G^4 で置換されてもよい（酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の）複素環基を示し、 R^{11} および R^{12} はそれぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、または C_{2-6} アルキニル基を示し、 R^{13} および R^{14} はそれぞれ独立して C_{1-6} アルキル基を示し、 R^{13} および R^{14} は結合して環を形成してもよい。]

で表される置換基のいずれかを示し、 m は0または1～5の整数を示す。

R^2 は、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 G^4 で置換されてもよい（酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の複素環基）、または C_{1-6} ハロアルコキシ基を表し、 k は0または1～4の整数を示す。

R^3 、 R^{31} 、 R^4 、 R^{41} 、 R^5 、 R^{51} 、 R^6 、 R^{61} および R^7 は、それぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、または C_{1-6} アルコキシ基を示し、 R^3 と R^4 、または R^5 と R^6 は一緒になって飽和環を形成してもよい。

X は、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、またはスルホニル基を示す。

G^1 は、水酸基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、 G^4 で置換されてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の複素環基）複素環基、または C_{3-6} シクロアルキル基を示す。

G^2 は、水酸基、シアノ基、 G^4 で置換されていてもよいアミノ基、 C_{1-6} アルコ

キシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-6} シクロアルキル基、またはハロゲン原子もしくは C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよい C_{6-10} アリール基を示す。

G^3 は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、または C_{1-6} アルキルスルホニル基を示す。

G^4 は C_{1-6} アルキル基、または C_{1-6} アルコキシ基を示す。

n は0または1を示す。]

で表される化合物、式 [I] で表される化合物の塩またはN-酸化物、およびそれらを有効成分として含有してなる有害生物防除剤である。

発明を実施するための最良の形態

本発明において、式 [I] におけるハロゲン原子の例としてフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等を挙げることが出来る。

C_{1-6} アルキル基の例として、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 t -ブチル、ペンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等を挙げることが出来る。

C_{2-6} アルケニル基の例としてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル等を挙げることができる。

C_{2-6} アルキニル基の例としてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-3-ペンチニル、1-ヘキシニル、1, 1-ジメチル-2-ブチニル等を挙げることが出来る。

C_{1-6} ハロアルキル基の例として、クロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、トリクロロメチル、

トリフルオロメチル、モノブロモジフルオロメチル、トリフルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、1-ブロモエチル、2-ブロモエチルペンタフルオロエチル、1-フロロプロピル、2-フロロプロピル等を挙げることが出来る。

C₁₋₆ハロアルケニル基の例として、3-クロロ-2-プロペニル、3, 3-ジクロロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4, 4-ジクロロ-3-ブテニルオキシ、4, 4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルカルボニル基の例として、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、ブチルカルボニル等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルコキシ基の例として、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆ハロアルコキシ基の例として、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ、フルオロエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ、3-クロロプロポキシ等を挙げることが出来る。

C₂₋₆アルケニルオキシ基の例として、ビニルオキシ、アリルオキシ、アレニルオキシ、ブテニルオキシ、3-メチル-2-ブチレンオキシ等を挙げることが出来る。

C₂₋₆ハロアルケニルオキシ基の例として、3-クロロ-2-プロペニルオキシ、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、4-クロロ-2-ブテニルオキシ、4, 4-ジクロロ-3-ブテニルオキシ、4, 4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₂₋₆アルキニルオキシ基の例として、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ、2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基の例として、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルコキシカルボニルオキシ基の例として、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルチオカルボニルオキシ基の例として、メチルチオカルボニルオキシ、エチルチオカルボニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルチオ基の例として、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆ハロアルキルチオ基の例として、モノフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルスルフィニル基の例として、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル等を挙げることが出来る。

C₁₋₆ハロアルキルスルフィニル基の例として、トリフルオロメチルメチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルスルホニル基の例として、メチルスルホニル、エタンスルホニル等を挙げることが出来る。

C₁₋₆ハロアルキルスルホニル基の例として、トリフルオロメチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルキルスルホニルオキシ基の例として、メチルスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆ハロアルキルスルホニルオキシ基の例として、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、ペンタフルオロエチルスルホニルオキシ等を挙げることが出来る。

C₁₋₆アルコキシアルコキシ基の例として、メトキシメトキシ、メトキシエトキシ、エトキシメトキシ等を挙げることが出来る。

C₃₋₆シクロアルキル基の例として、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、1-メチルシクロペンチル、シクロヘキシル、1-メチルシクロヘキシル、4-メチルシクロヘキシル等を挙げることが出来る。

C₆₋₁₀アリール基の例として、フェニル、ナフチル等を挙げることが出来る。

酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の複素環基の例としては、テトラヒドロフリル、ジオキサラニル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、オキサゾリル、1, 3-ジオキサラニ

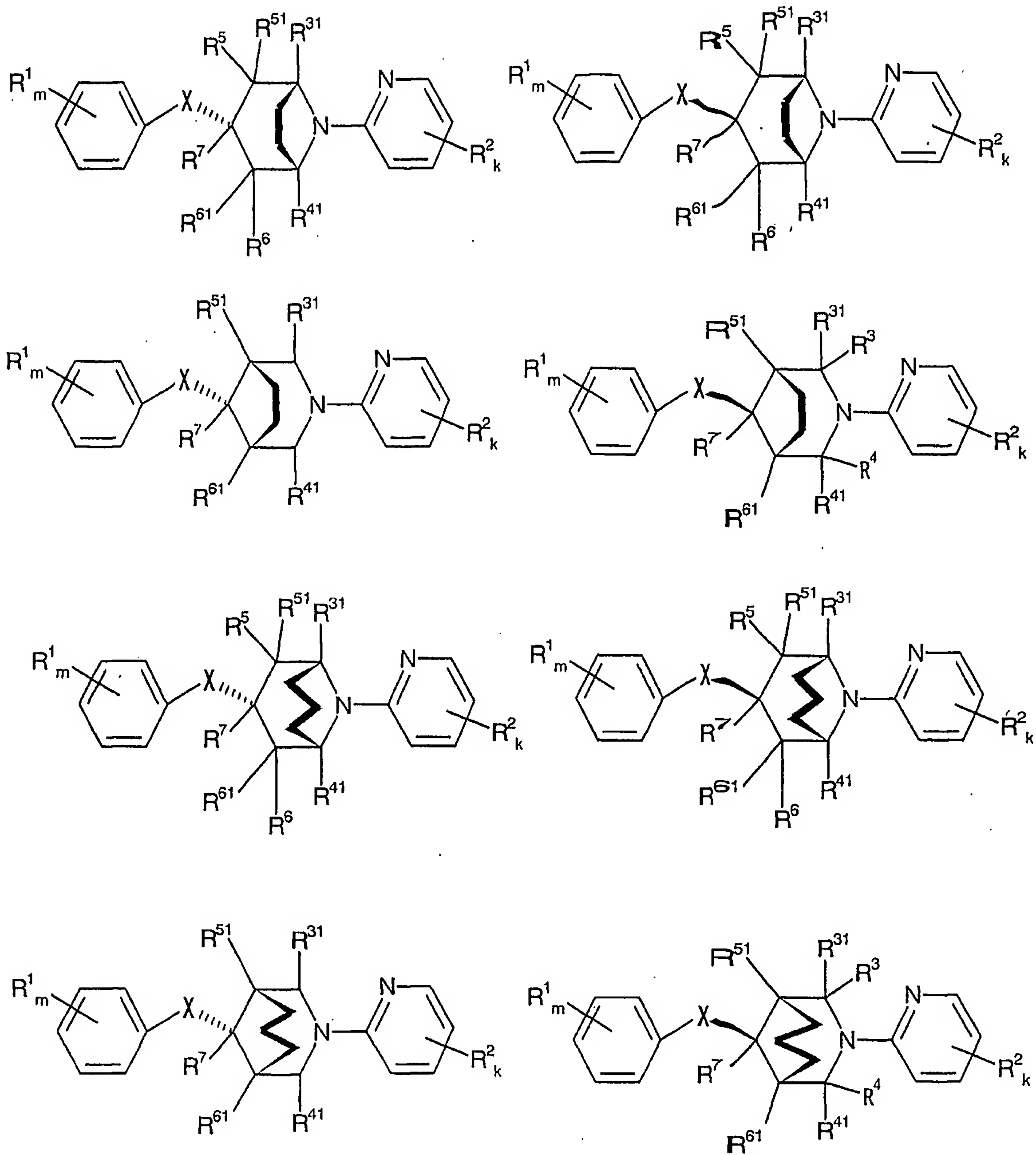
ル、チエニル、ピリジル、4, 5-ジヒドロフリル、フリル、等を挙げることが出来る。

mは0または1～5の整数を表し、複数個の R^1 を有する場合、ドウイツ又は互いに異なっていて良い。kは0または1～4の整数を表し、複数個の R^2 を有する場合、同一または互いに異なっていて良い。

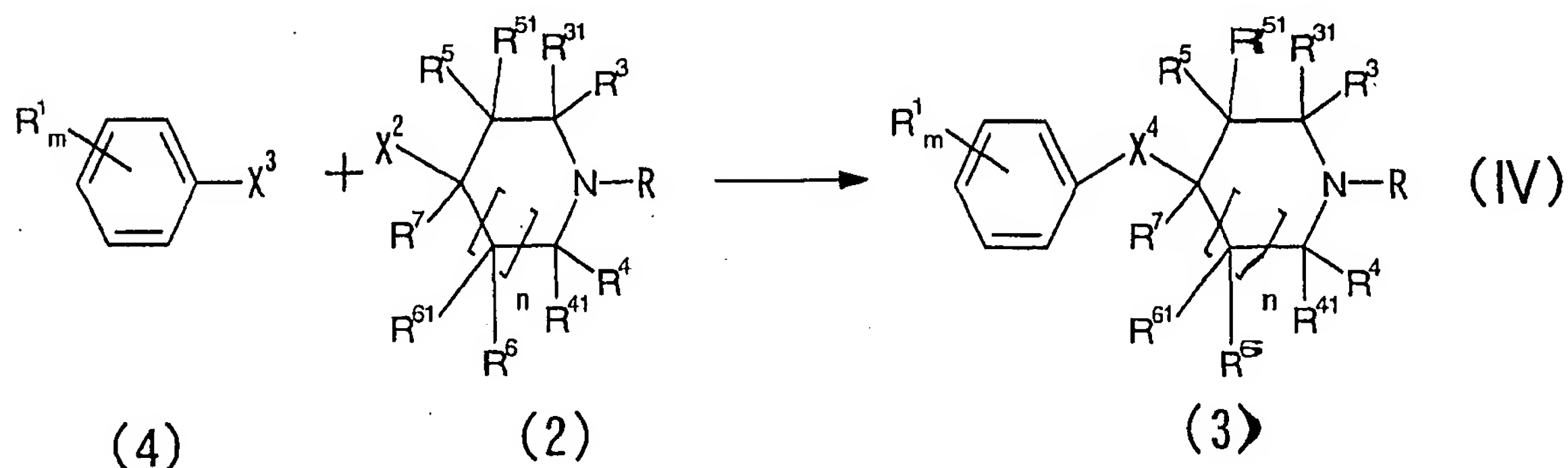
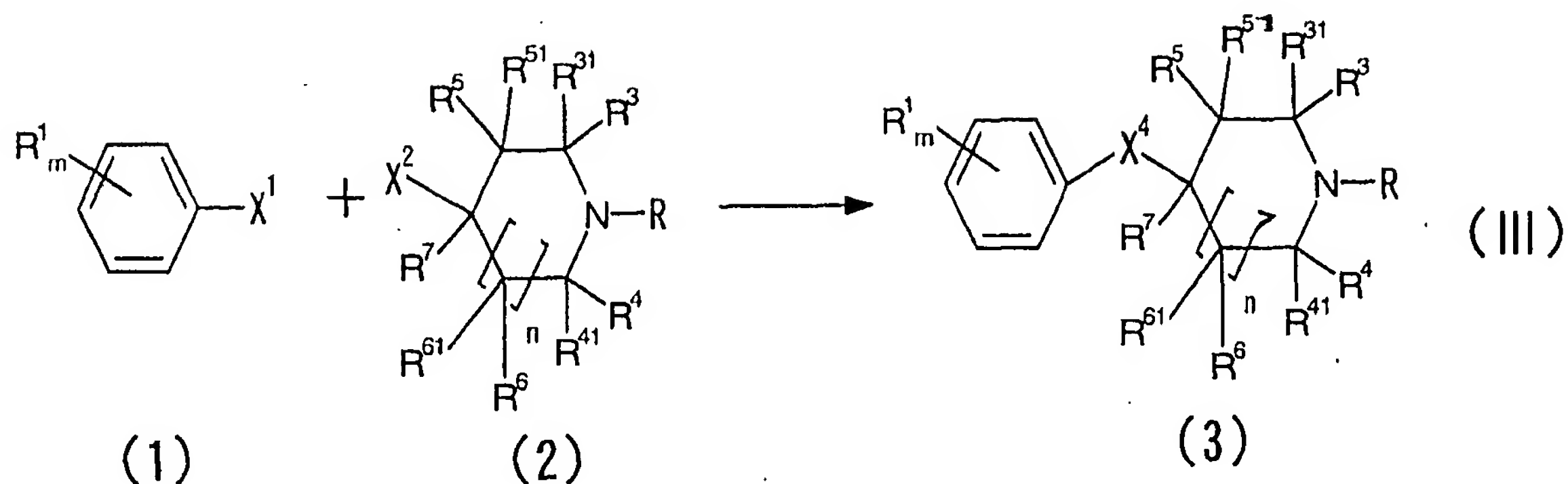
式[I]の R^3 と R^4 または R^5 と R^6 は一緒になって飽和環を形成してもよい。 R^3 と R^4 または R^5 と R^6 は一緒になって飽和環を形成し、全体として、例えば、8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環（以下トロパン環と称する）、3-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環（以下、イソトロパン環と称する）、3-アザビシクロ[3. 3. 1]ノナン等の橋かけ環を形成してもよい。

また、本発明化合物[I]のピリジン環の窒素原子やピペリジン環、トロパン環、イソトロパン環等の環状アミン部の窒素原子が酸化された化合物が存在するが、これらのN-酸化物も全て本発明に含まれる。

本発明化合物[I]の R^3 と R^4 とが、または R^5 と R^6 とが一緒になって飽和環を形成する場合、以下の例に示すような2種ずつの異性体が存在する。これらの異性体は全て本発明に含まれる。



次に、本発明化合物の製造法について説明する。まず、中間体（３）の製造方法について説明する。



[式中、 $R^1 \sim R^7$ 、 R^{31} 、 R^{41} 、 R^{51} 、 R^{61} 、 m および n は式 [I] と同じ意味を示し、 X^1 、 X^2 はそれぞれ独立して水酸基またはチオールを示し、 X^3 は、ハロゲン原子等の脱離基を示し、 X^4 は酸素原子またはイオウ原子を示す。また、 R は、 R^2_k で置換された2-ピリジル基、メチル基、ベンジル基のいずれかを示す。]

中間体 (3) は、反応式 (III) に示すとおり、化合物 (1) と化合物 (2) との形式的な脱水反応、例えば、光延反応 (例えば、Tetrahedron Lett., 1978, 2243 や J. Org. Chem., 50, 3095, 1985 などに記載された方法) により、中間体 (3) を製造することが出来る。なお、化合物 (1) については、公知の方法 (例えば、"The Chemistry of Phenols," Eds. Z. Rappoport, J. Wiley (2003), Part 1, pp 395 等に記載の方法) に準じて製造することができる。

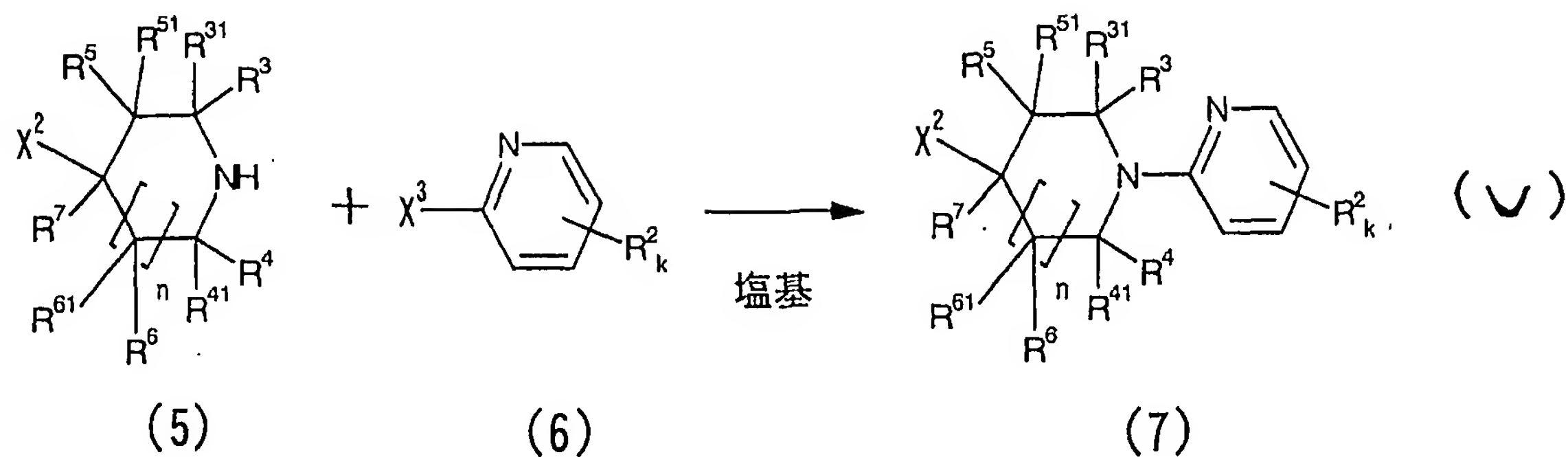
また、反応式 (IV) に示すとおり、アリールハライド (4) と化合物 (2) とのカップリングによっても中間体 (3) を製造することができる。具体的には、公知の方法 (例えば、Synth. Commun., 1984, 14, 621; J.

Org. Chem., 48, 3771 (1983) または、J. Med. Chem., 17, 1000 (1974) 等に記載された方法) に準じて製造することができる。

この際、使用できる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩、ナトリウムメトキシド、カリウム、*t*-ブトキシド、マグネシウムエトキシド等の金属アルコキシド、*n*-ブチルリチウム、LDA等の有機金属、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基等が挙げられる。本反応は溶媒存在下または無溶媒で行うことができる。使用できる溶媒としては、反応に不活性な溶媒であれば特に限定されず、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオンニトリル等のニトリル系溶媒、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)等の非プロトン性極性溶媒、およびこれらの溶媒を二つ以上混合した混合溶媒系が挙げられる。反応温度は-78℃から用いる溶媒の沸点までの温度範囲から任意の温度で反応させることができる。

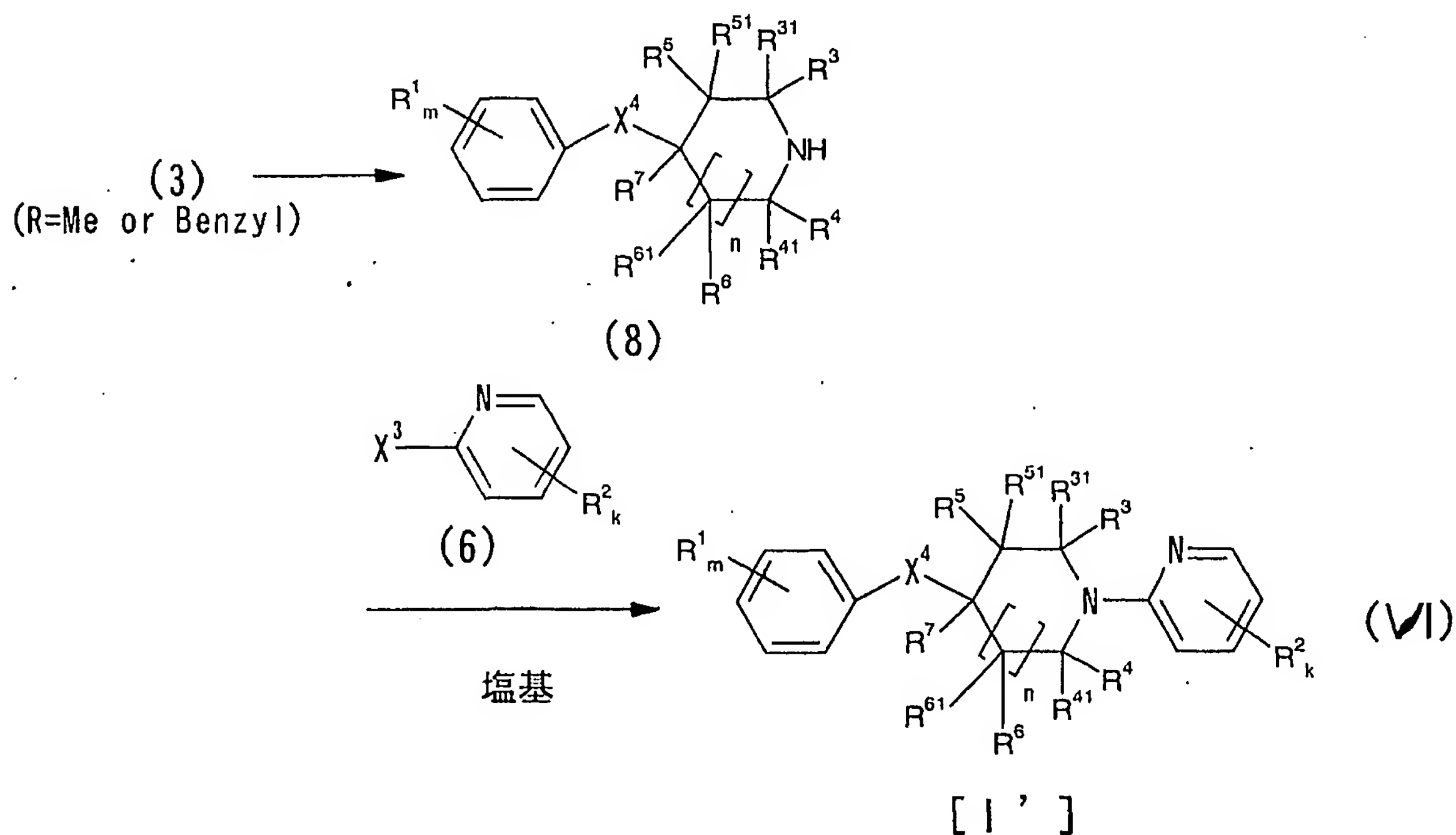
化合物(2)において、Rが、R₂で置換された2-ピリジル基の場合(化合物(7))、反応式(III)または反応式(IV)により、直接的に、本発明化合物[I]を製造できる。

なお、化合物(7)は、反応式(V)に示すとおり、アミン(5)と2-ハロピリジン(6)とのカップリングによって合成することができる。具体的には、公知の方法(例えば、Synthesis, 1981, 606; J. Chem. Soc., C, 3693 (1971) 等に記載された方法) に準じて製造することができる。



[式中、 $R^2 \sim R^7$ 、 R^{31} 、 R^{41} 、 R^{51} 、 R^{61} 、 n 、 X^2 、 X^3 は、上記と同じ意味を示す。]

一方、化合物(2)において、 R が、メチル基またはベンジル基の場合は、反応式(III)または反応式(IV)により得られた中間体(3)から、脱メチル化または脱ベンジル化を行う必要がある。脱メチル化は公知の方法(例えば、Tetrahedron Lett., 1974, 1325; ibid., 1977, 1565; ibid., 1995, 8867等に記載の方法)に準じて行うことができる。また、脱ベンジル化は、公知の接触水素還元などを用いることができる。反応式(VI)に示すように、中間体(3)から、中間体(8)を得、次いで、2-ハロピリジン(6)とのカップリングによって、本発明化合物[I']を製造できる。このカップリングの具体的な方法は、反応式(V)と同様である。



なお、化合物(2)(R が、メチル基またはベンジル基)は、市販品をそのまま

使用できる。また、中間体（８）は、アミンとして単独で、または、塩酸や酢酸などと塩を形成して存在してもよい。

以上の縮合反応終了後は、生成物の精製が必要であれば、蒸留、再結晶またはカラムクロマトグラフィー等の公知慣用の方法により精製することができる。

本発明化合物（式〔I〕で表される化合物、その塩またはN-酸化物）は農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のもので挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシנקイガ、ナシヒメシנקイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロピアンコーンボークーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属、アグロティス属、イガ、コドリंगा、ワタアカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、シルバーリーフコナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、

甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、

アザミウマ目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、

直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等

シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ、ネコノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

ダニ類、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、プレビパルパス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシンガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

適用が好ましい有害生物としては、鱗翅目害虫、半翅目害虫、ダニ類、アザミウマ目害虫、甲虫目害虫であり、特に好ましくは、ダニ類である。

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や、殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。

また本発明化合物は薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することもできる。

本発明化合物の中には、殺菌活性、除草活性、植調作用を示すものもある。また本発明化合物の中間体化合物の中には殺虫・殺ダニ活性を示すものもある。

本発明殺虫・殺ダニ剤は本発明化合物の1種又は2種以上を有効成分として含有する。本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えずそのまま使用できるが、通常は、さらに固体担体、液体担体、ガス状担体と混合し、または多孔セラミック板や不織布等の基剤に含浸し、必要により界面活性剤、その他の補助剤

を添加して、農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、毒餌、マイクロカプセル等の形態に製剤化して使用する。

添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用することができる。噴射剤に用いられるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテルおよび炭酸ガスを使用することができる。

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチック酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料等の害虫誘引性香料を使用することができる。

これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合物等が挙げられる。

本発明化合物を農業用の有害性物防除剤として使用する場合、その製剤中の有効成分量は0.01～90重量%であり、とくに好ましくは0.05～85重量%であり、水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤、水溶剤、顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのま

ま植物或いは土壤に散布する方法で使用される。

また、本発明化合物を防疫用の有害生物防除剤として使用する場合には、乳剤、水和剤、フロアブル剤等は水で所定の濃度に希釈して施用し、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシート等についてはそのまま施用する。

本発明化合物をウシ、ブタ等の家畜類、イヌ、ネコ等のペット類の動物外部寄生虫防除用の有害生物防除剤として使用する場合は、通常本発明化合物の製剤を、獣医学的に公知の方法で使用する。その方法としては、例えば全身的抑制（systemic control）を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）等により投与方法が挙げられ、非全身的（non-systemic control）を目的とする場合は、油性又は水性液剤を噴霧、注ぎかけ（pour-on）、滴下（spot-on）等により投与方法および樹脂製剤を首輪、耳札等の適当な形状に成形した物を装着する方法が挙げられる。この場合、通常宿主動物 1 kg に対して、本発明化合物として 0.01 - 1000 mg の割合で使用される。

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることは言うまでもないが、他の有害生物防除剤、殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、除草剤、植物調節剤、共力剤、肥料、土壤改良剤、動物用飼料等の 1 種又は 2 種以上と混用または併用することもできる。

本発明化合物と混用または併用することのできる殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤等の有効成分の代表例を以下に示す。

殺菌剤：

キャプタン、フォルペット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニン、キントーゼン、キャプタホル、イプロジオン、プロサイミドン、ビンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、オキシカルボキシシン、ホセチルアルミニウム、プロパモカーブ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロブトラゾール、ピテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルシラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ペンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ペフラゾエート、トリデ

モルフ、フェンプロピモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシシ、メタラキシ、オキサジキシ、フララキシ、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、ブラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルベンダジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナート、ビナパクリル、レシチン、重曹、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メパニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロパモカルブ塩酸塩、オキシソリニック酸。

殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェニトロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等。

ピレスロイド系殺虫剤：

ペルメトリン、シペルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリ

ン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロックス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフエン、アクリナトリン等。

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトプレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、アセタミプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、B Tや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、B P P S、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、C P C B S、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

植物生長調節剤：

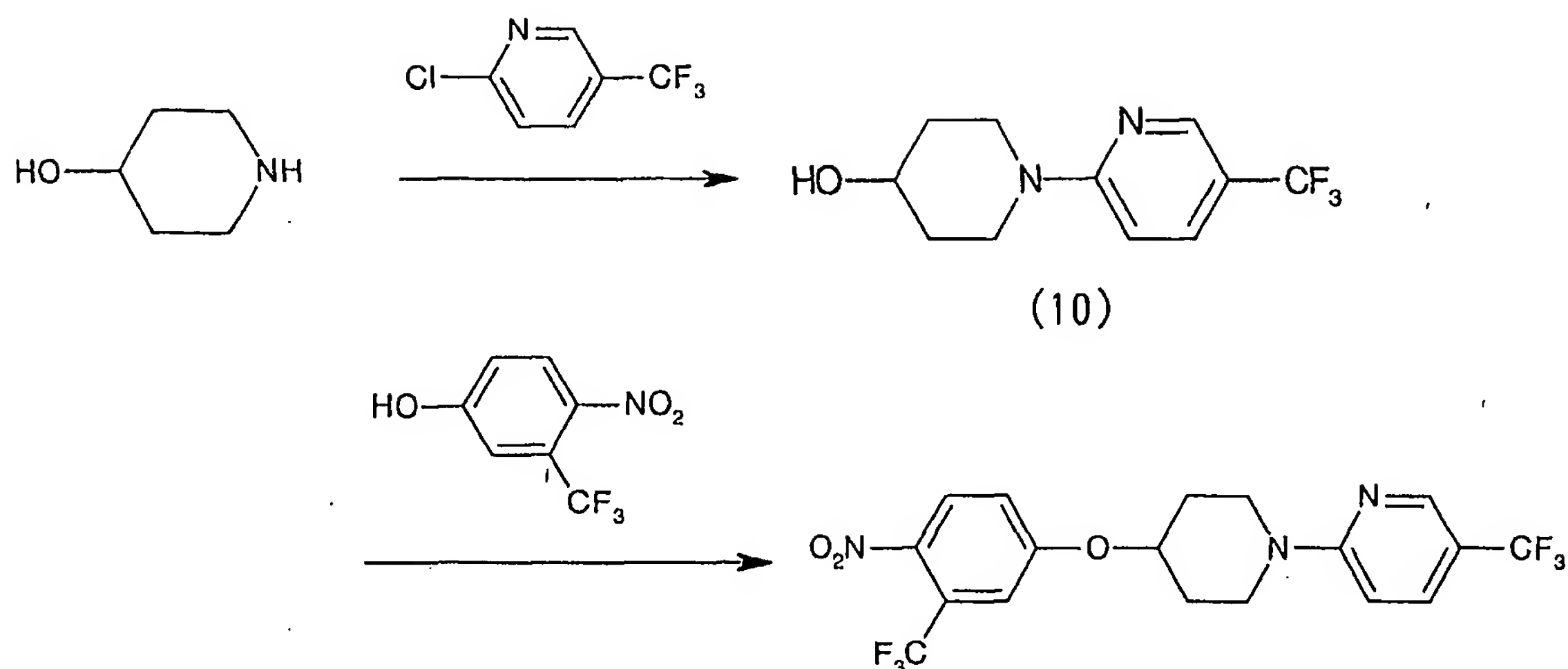
ジベレリン類（例えばジベレリンA 3 、ジベレリンA 4 、ジベレリンA 7 ）
I A A、N A A。

実施例

次に、実施例を挙げて、本発明をさらに詳細に説明するが、本発明はこれらの実施例のみに限定して解釈されるものでない。

製造例 1

4 - [4 - ニトロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 1 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - ピペリジンの製造 (化合物番号 1 - 3 9)



4-ヒドロキシピペリジン (3.0 g)、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (5.4 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、トリエチルアミン (4.5 g) を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を水に注いで、クロロホルムで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、化合物 (10) (5.98 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

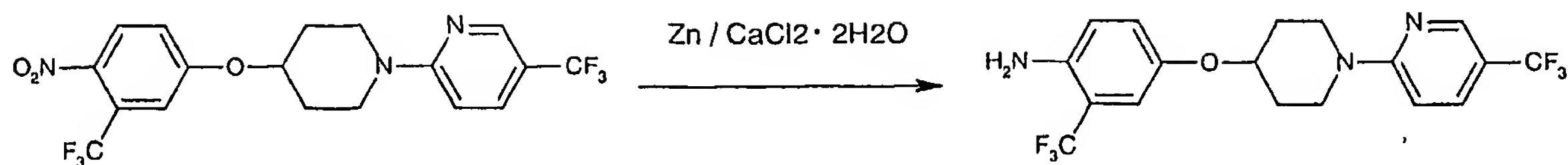
化合物 (10) (4.9 g)、5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾトリフルオリド (3.2 g)、およびトリフェニルホスフィン (5.6 g) の THF (30 ml) 溶液に、氷冷下、アゾジカルボン酸ジイソプロピルエステル (4.3 g) の THF (30 ml) 溶液を滴下した。混合物を室温に昇温して3時間攪拌した後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (5.98 g) を得た。

viscous oil

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.86–1.97 (m, 2H), 2.04–2.14 (m, 2H), 3.64–3.72 (m, 2H), 3.90–3.99 (m, 2H), 4.71–4.77 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

製造例 2

4-[4-アミノ-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-ピペリジンの製造 (化合物番号 1-168)



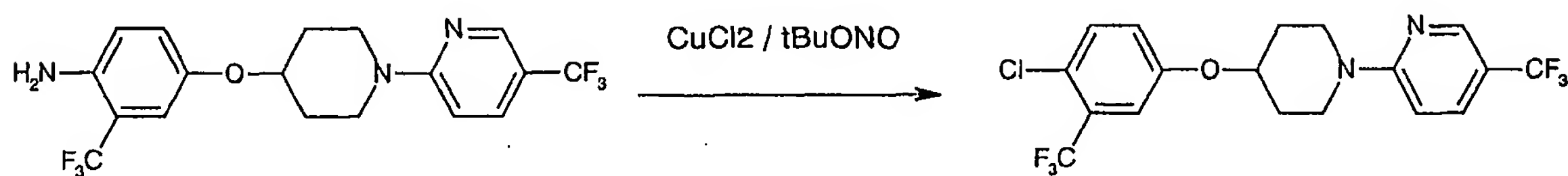
製造例 1 で得られたピペリジン（化合物番号 1-39、5.7 g）のエタノール（300 ml）溶液に、亜鉛末（18.8 g）、塩化カルシウム 2 水和物（1.9 g）を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をクロロホルムで希釈、水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物（5.4 g）を得た。

$n_D^{21.6}$ 1.5259

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.77-1.88 (m, 2H), 1.94-2.04 (m, 2H), 3.53-3.61 (m, 2H), 3.90-3.99 (m, 3~4H), 4.38-4.45 (m, 1H), 6.69 (t, 2H), 7.00 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

製造例 3

4-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-ピペリジンの製造（化合物番号 1-15）



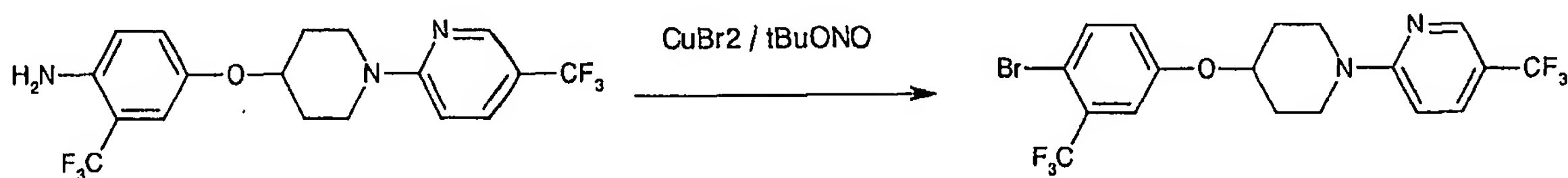
塩化銅（Ⅱ）（0.14 g）のアセトニトリル（5 ml）懸濁液に、氷冷下、亜硝酸 *t*-ブチル（0.13 g）を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、氷冷下、製造例 2 で得られたピペリジン（化合物番号 1-168、0.35 g）のアセトニトリル（3 ml）溶液を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 1 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物（0.2 g）を得た。

$n_D^{21.9}$ 1.5275

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.82–1.92 (m, 2H), 1.99–2.08 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.89–3.97 (m, 2H), 4.56–4.63 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

製造例 4

4-[4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-ピペリジン (化合物番号 1-23 の製造)



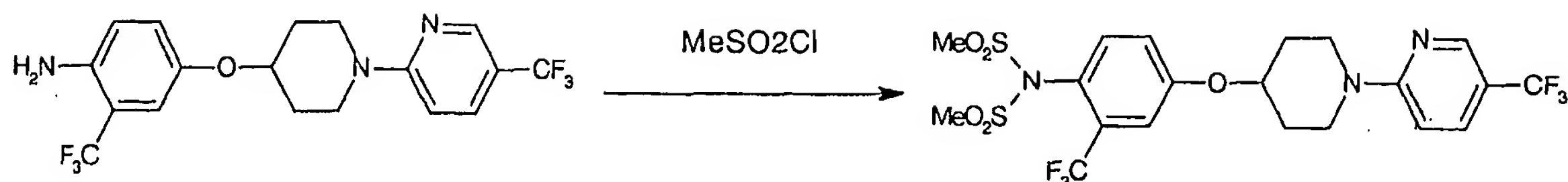
臭化銅 (II) (0.22 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、氷冷下、亜硝酸 *t*-ブチル (0.12 g) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、氷冷下、製造例 2 で得られたピペリジン (化合物番号 1-168、0.32 g) のアセトニトリル (2 ml) を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 2.5 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.21 g) を得た。

$n_D^{21.9}$ 1.5365

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.81–1.92 (m, 2H), 1.99–2.08 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.88–3.96 (m, 2H), 4.57–4.63 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

製造例 5

4-[4-ビス(メチルスルフォニル)アミノ]-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン (化合物番号 1-178) の製造



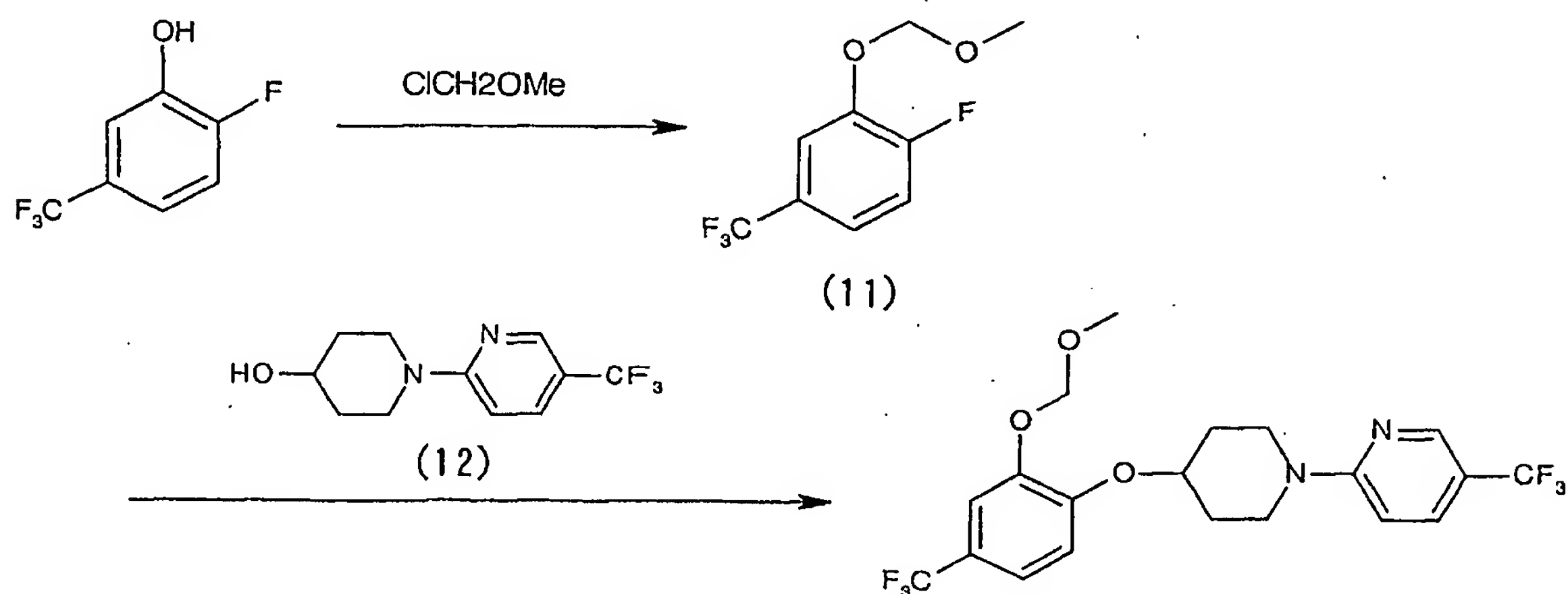
製造例 2 で得られたピペリジン（化合物番号 1-168、0.32 g）の THF（5 ml）溶液に、氷冷下、メタンスルホニルクロリド（0.09 g）とトリエチルアミン（0.08 g）を加えた。混合物を室温に昇温して 4 時間攪拌し、さらに 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物（0.20 g）を得た。

amorphous

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.87–1.96 (m, 2H), 2.01–2.10 (m, 2H), 3.47 (s, 6H), 3.64–3.73 (m, 2H), 3.88–3.96 (m, 2H), 4.64–4.69 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

製造例 6

4-[2-メトキシメトキシ-4-(トリフルオロメチル)-フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン（化合物番号 1-105）の製造



4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド（0.36 g）の DMF

(5 ml) 溶液に、60%水素化ナトリウム(88 mg)を加えて、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル(0.24 g)を滴下し、混合物を室温に昇温して5時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、粗製の化合物(11)(0.45 g)を得て、このまま次の反応に用いた。

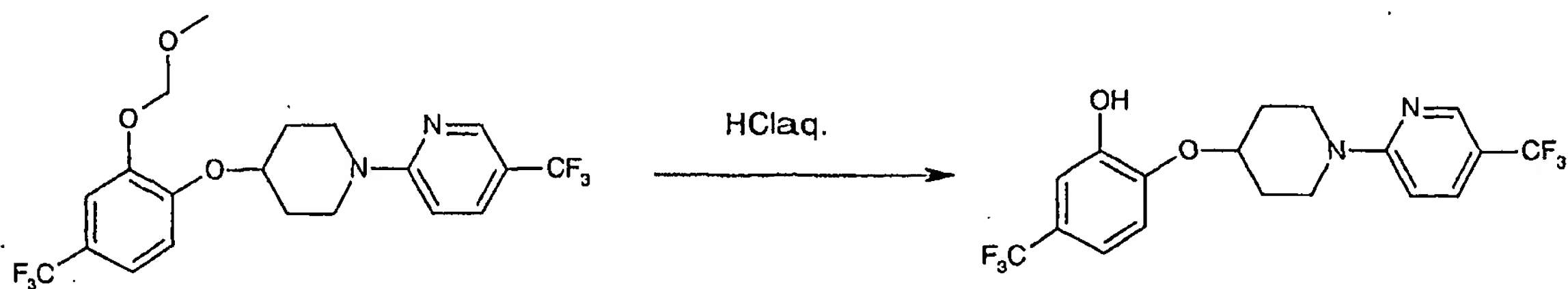
ピペリジノール (12) (0.49 g) の DMF (5 ml) 溶液に、室温で、60%水素化ナトリウム (90 mg) を加えた。混合物を10分間攪拌した後に、ベンゾトリフルオリド (11) の DMF (5 ml) 溶液を加えて、約100℃まで昇温して、一晚攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.56 g) を得た。

$n_D^{23.9} \quad 1.4969$

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.87–1.96 (m, 2H), 2.00–2.08 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 3.56–3.65 (m, 2H), 3.95–4.03 (m, 2H), 4.61–4.65 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 6.69 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

製造例 7

4 - [2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 1 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] ピペリジン (化合物番号 1 - 4) の製造



製造例 6 で得られたピペリジン（化合物番号 1-105、0.38 g）の THF（5 ml）溶液に、室温で 10% 塩酸水（5 ml）を加えた。混合物を 2 時間

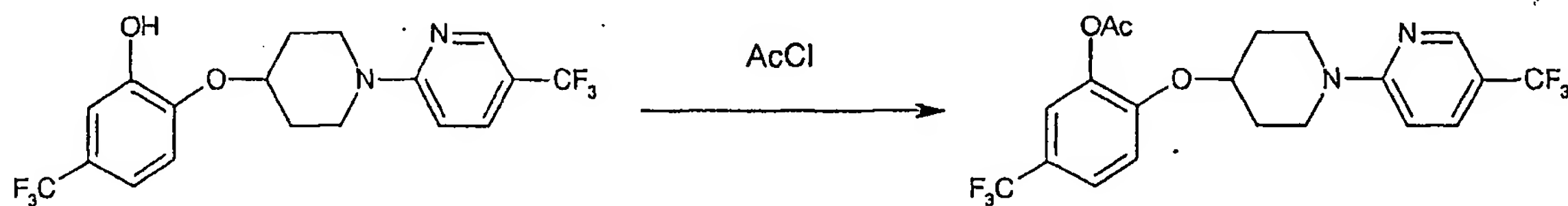
撈拌した後、10%塩酸水(5ml)を加えて、一晚撈拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物(0.31g)を得た。

viscous oil

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.85-1.94 (m, 2H), 2.11-2.17 (m, 2H), 3.48-3.57 (m, 2H), 4.02-4.10 (m, 2H), 4.66-4.70 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

製造例8

4-[2-アセトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン(化合物番号1-167)の製造



製造例7で得られたピペリジン(化合物番号1-105、0.17g)とトリエチルアミン(50mg)のアセトニトリル(5ml)溶液に、氷冷下、塩化アセチル(36mg)を加えた。混合物を室温に昇温して3時間撈拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物(0.22g)を得た。

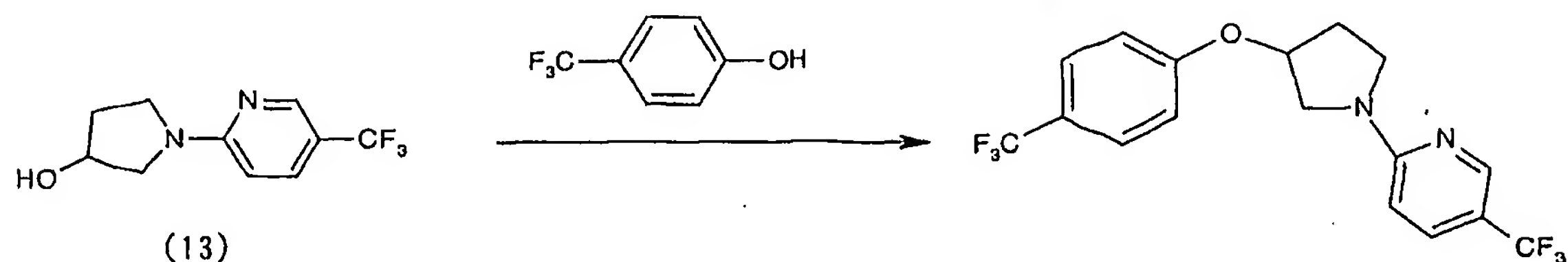
mp. 85-95°C

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.88-2.05 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 3.70-3.84 (m, 4H), 4.68-4.70 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

製造例9

3-[4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメ

チル) - 2 - ピリジル] ピロリジンの製造 (化合物番号 8 - 6 3)



ピロリジノール(13)(0.35 g)と4-トリフルオロメチルフェノール(0.16 g)を用いて、実施例1と同様の方法により、標記化合物(0.32 g)を得た。なお、化合物(13)は、製造例1の化合物(10)と同様の方法により調整した。

mp. 109 - 112°C.

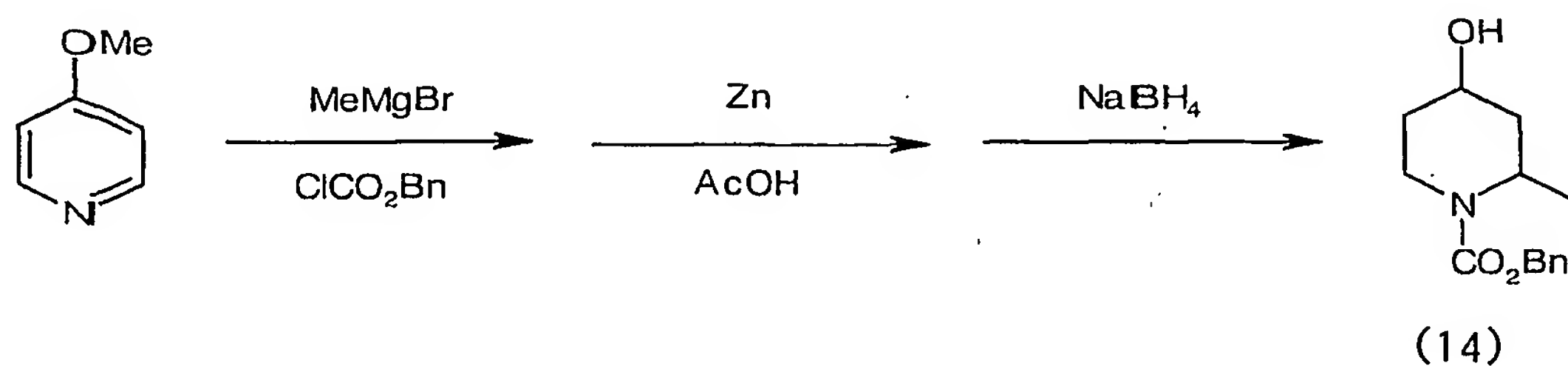
^1H NMR (CDCl₃) δ 2.26 - 2.46 (m, 2H), 3.62 - 3.75 (m, 2H), 3.85 (s, 2H), 5.10 - 5.15 (m, 1H), 6.42 (d, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.56 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

製造例 10

2-メチル-4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン(化合物番号 1-93)の製造

工程 1

1-ベンジルオキシカルボニル-2-メチル-4-ピペリジノール(14)の製造



以下の反応は、Tetrahedron Lett. 1986, 27, 4549 に記載された方法に従った。

4-メトキシピリジン(2.50 g)のTHF(25 ml)溶液に、-30°Cから-20°Cに保ちながら、メチルマグネシウムブロミド(3.0 Mエーテル溶液、

7. 6 ml) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後、 -30°C から -20°C に保ち、クロロギ酸ベンジル (3.90 g) を滴下した。混合物を 30 分間攪拌した後、室温まで昇温した。混合物を 10% 塩酸に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して油状物 (5.34 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

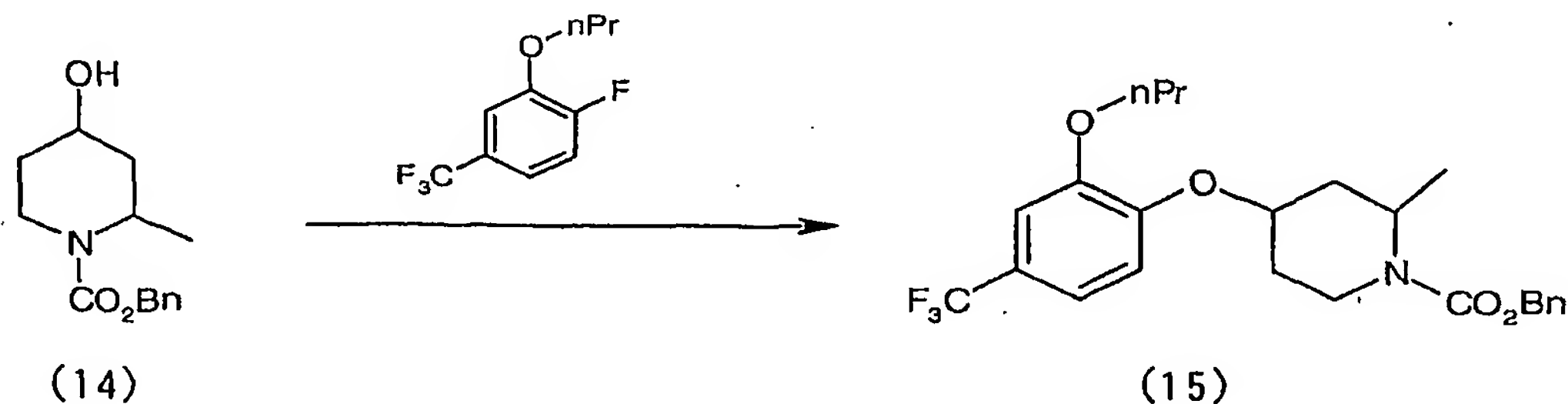
以下の反応は、J. Org. Chem., 2001, 66, 2181 に記載された方法に従った。

この油状物を酢酸 (150 ml) に溶解し、室温で亜鉛 (21.4 g) を加えた。懸濁液を 6 時間加熱還流した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。残渣に水を加え、水酸化ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状物 (5.01 g) を得た。この油状物 (2.47 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、室温で水素化ホウ素ナトリウム (0.38 g) を加え、混合物を 1 時間攪拌した。混合物を減圧濃縮し、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の化合物 (14) (2.39 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.16–1.93 (m, 7H), 2.95–3.37 (m, 1H), 3.88–4.70 (m, 3H), 5.13 (m, 2H), 7.35 (m, 5H)

工程 2

1-ベンジルオキシカルボニル-2-メチル-4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピペリジンの製造



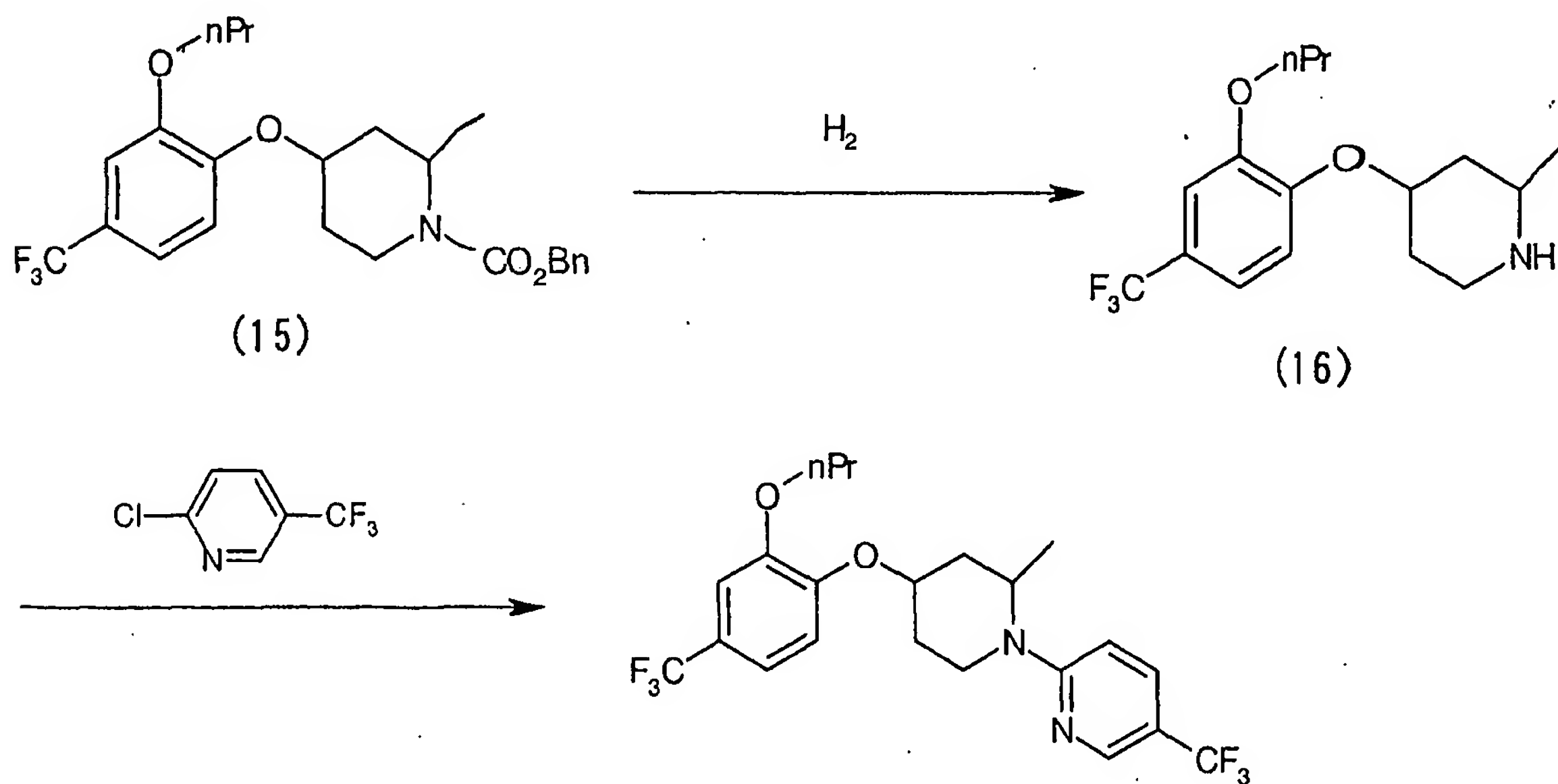
化合物 (14) の DMF (25 ml) に、室温で、60% 水素化ナトリウム (0.42 g) を加えた。混合物を 30 分間攪拌した後、4-フルオロ-3-プロポキ

シベンゾトリフルオライド (2.13 g) を加え、100℃に昇温して一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (15) (1.02 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.05 (t, 3H), 1.26 (m, 3H), 1.50 – 2.04 (m, 6H), 3.00 – 3.40 (m, 1H), 3.92 – 4.16 (m, 3H), 4.50 – 4.73 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 6.93 (m, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.33 (m, 5H)

工程 3

2-メチル-4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン]の製造



化合物 (15) のエタノール (25 ml) 溶液に、5%パラジウム-炭素 (0.20 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、80℃で8時間加熱した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物 (16) (0.70 g) を得た。

このピペリジンのアセトニトリル (15 ml) 溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (4.0 g) と炭酸カリウム (1.53 g) を加え、

混合物を3日間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(30mg)を得た。

viscous oil

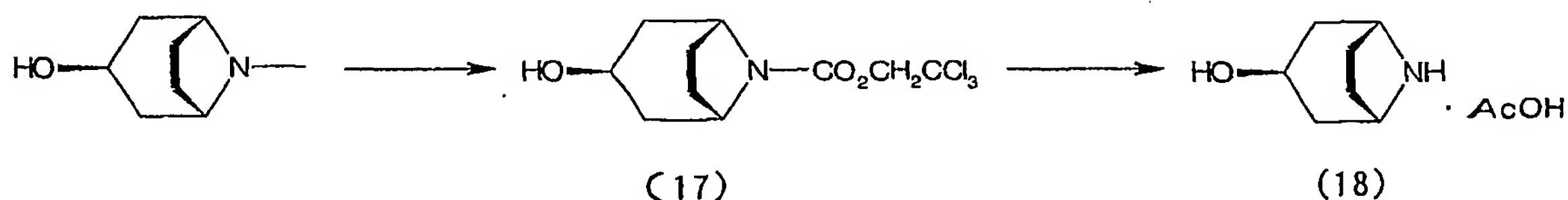
^1H NMR (CDCl₃) δ 1.04 (t, 3H), 1.23 (d, 3H), 1.71–1.97 (m, 4H), 2.10–2.26 (m, 2H), 3.05 (m, 1H), 3.98 (t, 2H), 4.43 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.00–7.26 (m, 3H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

製造例11

3 α -[2-メトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(化合物番号2-77)の製造

工程1

3 α -ヒドロキシ-8-アザボシクロ[3.2.1]オクタン酢酸塩(18)の製造

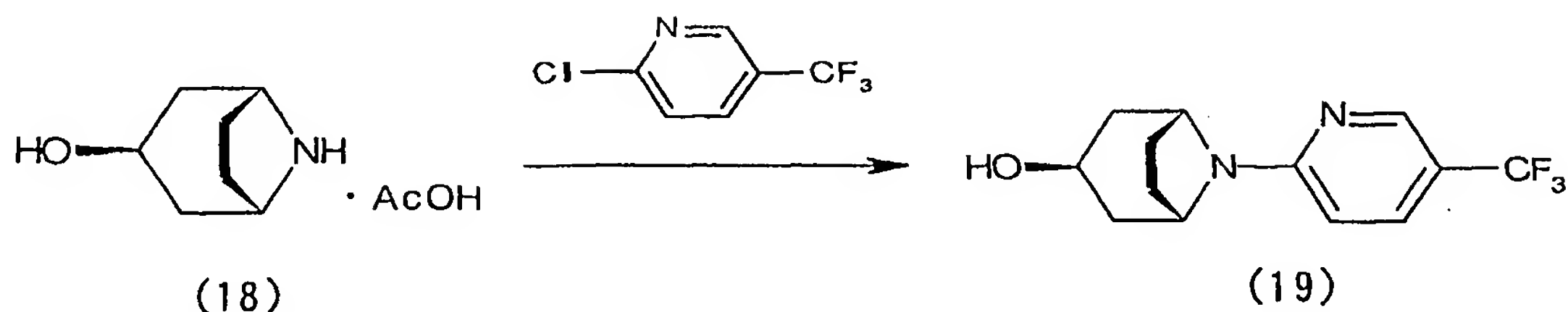


トロピン(14.1g)、炭酸カリウム(1.4g)のベンゼン(150ml)懸濁液に、クロロギ酸2,2,2-トリクロロエチルエステル(23.3g)を室温で加え、混合物を3.5時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状のカーボネート(17)を得て(30.08g)、そのまま次の反応に用いた。このカーボネート(17)の酢酸(250ml)溶液に、亜鉛末(65g)を加えた。混合物を5分間攪拌した後に、80℃で1時間加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ

過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(18)を得た(15.5g)。

工程2

3 α -ヒドロキシ-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(19)の製造

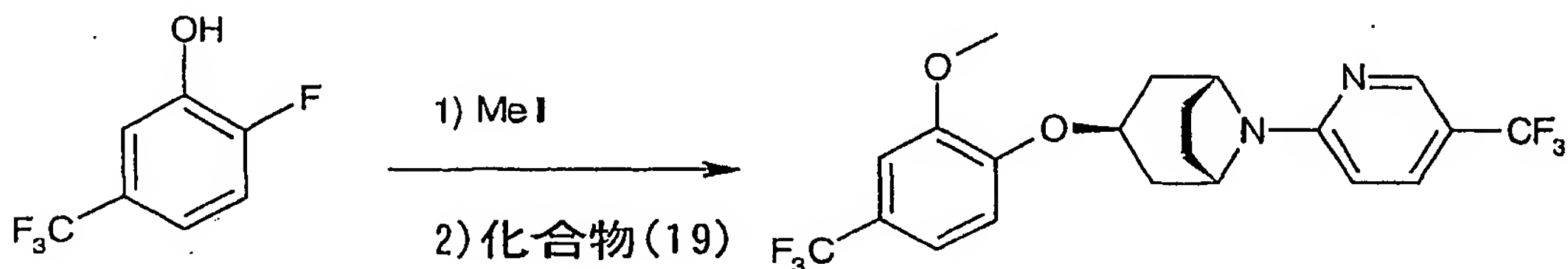


粗製の化合物(5.64g)、炭酸カリウム(41.5g)および2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン(8.2g)のアセトニトリル(150ml)懸濁液を3.5時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、結晶として化合物(19)を得た(3.5g)。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.42 (d, 1H), 1.77 (d, 2H), 2.05–2.20 (m, 4H), 2.32–2.39 (m, 2H), 4.09 (br s, 1H), 4.53 (br s, 2H), 6.52 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.38 (d, 1H)

工程3

3 α -[2-メトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタンの製造



4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(0.17g)のDMF(3ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(35mg)を加えた。混合物を20分間攪拌した後、ヨードメタン(0.11g)を加えて、60℃に昇

温して40分間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、化合物(19)(0.22g)と60%水素化ナトリウム(35mg)を室温に加え、100℃で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.18g)を得た。

viscous oil.

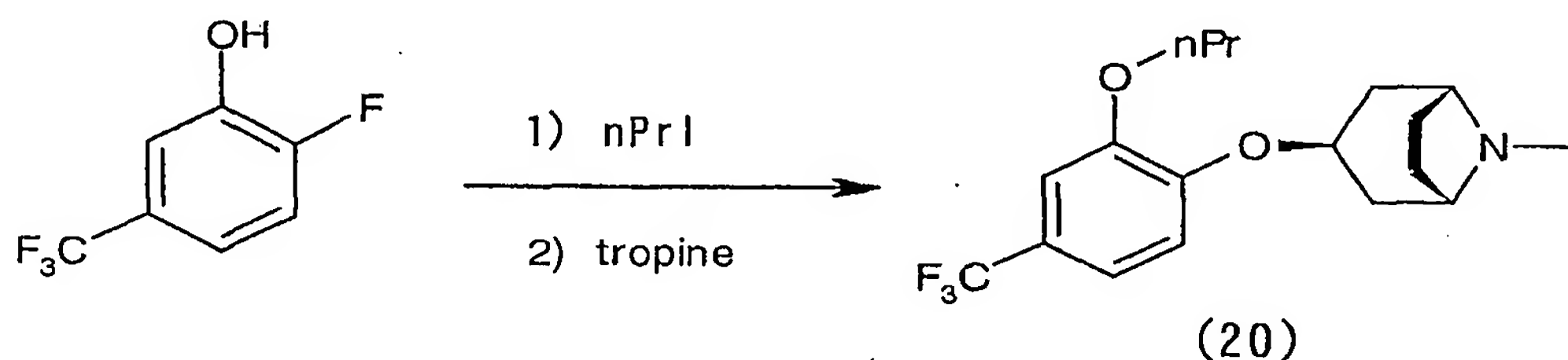
^1H NMR (CDCl₃) δ 2.00–2.22 (m, 6H), 2.38–2.44 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.56–4.61 (m, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (brd, 1H)

製造例12

3 α -[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(化合物番号2-82)の製造

工程1

8-メチル-3 α -[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(20)の製造



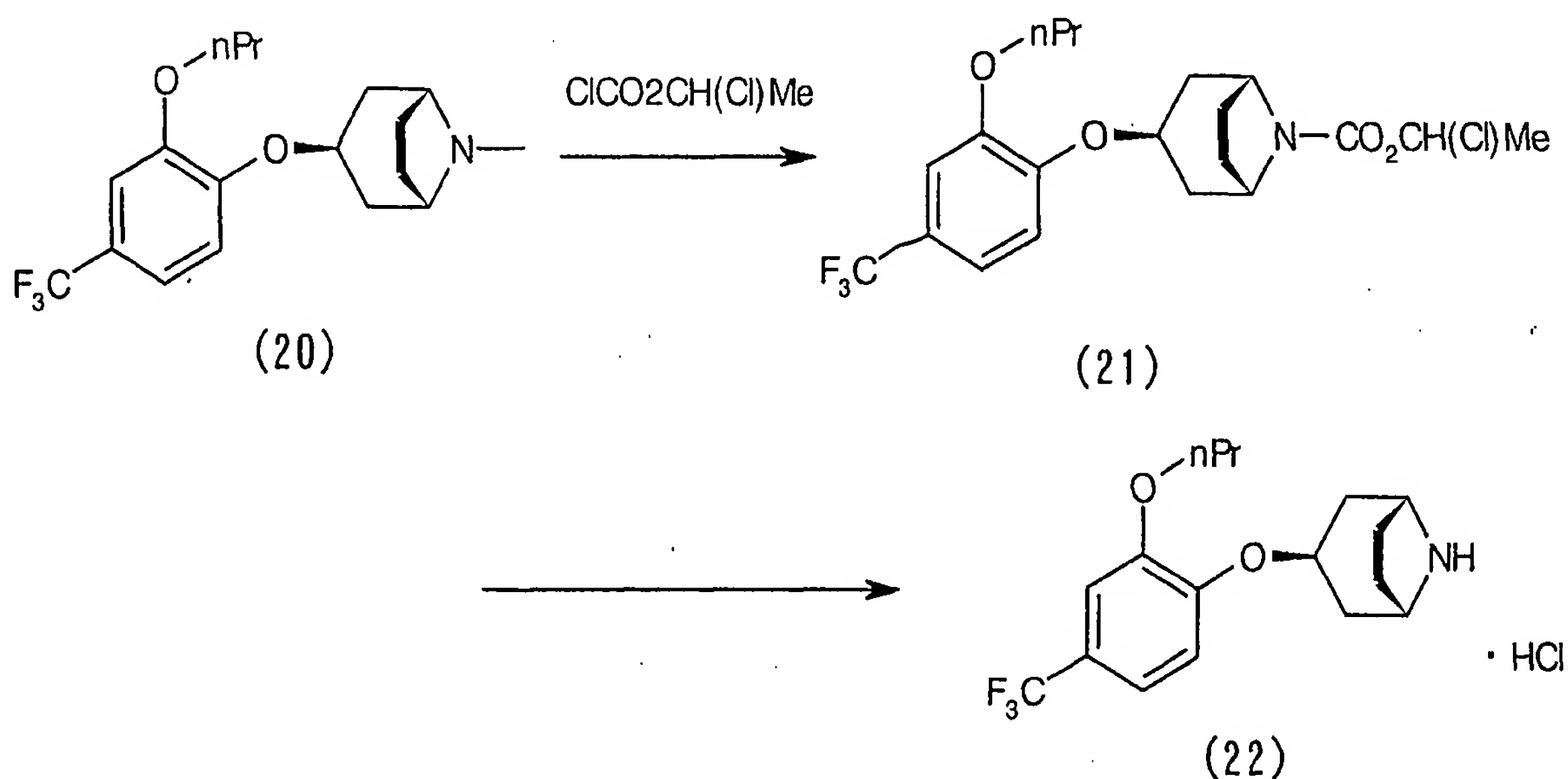
4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(1.8g)のDMF(15ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.44g)を加えた。混合物を20分間攪拌した後、1-ヨードプロパン(1.7g)のDMF(3ml)溶液を加えて、さらに4時間攪拌した。混合物にトロピン(1.42g)と60%水素化ナトリウム(0.43g)を室温に加え、100℃に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残

査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の化合物 (20) (1.1 g) を得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.08 (t, 3H), 1.83 (q, 2H), 1.90-2.20 (m, 8H), 2.30 (s, 3H), 3.10-3.11 (m, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.58 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.05 (s, 1H), 7.13 (d, 1H)

工程 2

3 α - [2 - プロポキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 8 - アザ
 ビシクロ [3. 2. 1] オクタン塩酸塩 (22) の製造



化合物 (20) (1.0 g) の塩化メチレン (6 ml) 溶液に、室温で、クロロギ酸 1-クロロエチルエステル (0.83 g) の塩化メチレン (4 ml) 溶液を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和重曹水、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製のカーバネート (21) を得て、このまま次の反応に用いた。

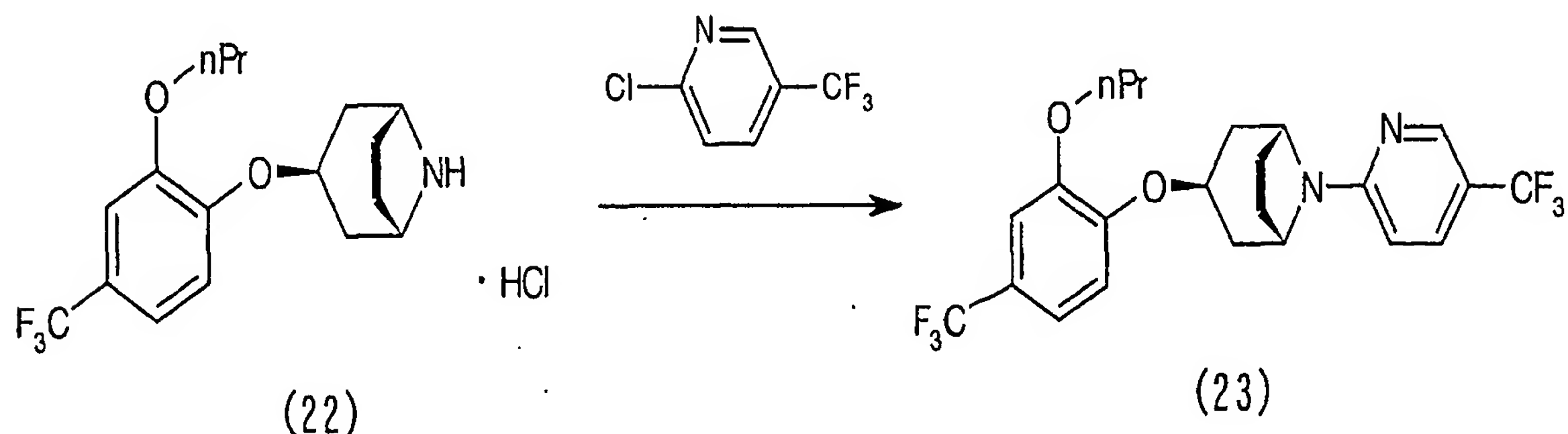
化合物 (21) にメタノール (6 ml) を加えて、2.5 時間加熱還流した。混合物を減圧濃縮して、粗製の (22) を得て、このまま次の反応に用いた。

¹H NMR of the salt-free (22) (CDCl₃) δ
1.10 (t, 3H), 1.61 (brs, 1H), 1.70–1.92 (m, 4
H), 2.01–2.09 (m, 4H), 2.20–2.31 (m, 2H), 3.5

2 (b r s, 2 H), 3. 9 5 (t, 2 H), 4. 6 3 – 4. 6 5 (m, 1 H), 6. 7 8 (d, 1 H), 7. 0 6 (s, 1 H), 7. 1 5 (d, 1 H)

工程 3

3 α - [2 - プロポキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 8 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1]
 オクタンの製造



粗製の (22)、トリエチルアミン (1.18 g)、および 2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチルピリジン (0.53 g) のエタノール (10 ml) 溶液を一晩加熱還流した。混合物に、トリエチルアミン (3 g)、2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチルピリジン (1.6 g) およびエタノール (10 ml) を加えて、さらに、一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.31 g) を得た。

m p. 90 - 92 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.09 (t, 3H), 1.82-1.93 (m, 2H),

2. 0 1-2. 2 3 (m, 6H), 2. 4 3-2. 5 0 (m, 2H), 3. 9 7 (t, 2H), 4. 5 6-4. 6 2 (m, 3H), 6. 5 5 (d, 1H), 6. 7 7 (d, 1H), 7. 0 8 (s, 1H), 7. 1 5 (d, 1H), 7. 6 0 (dd, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

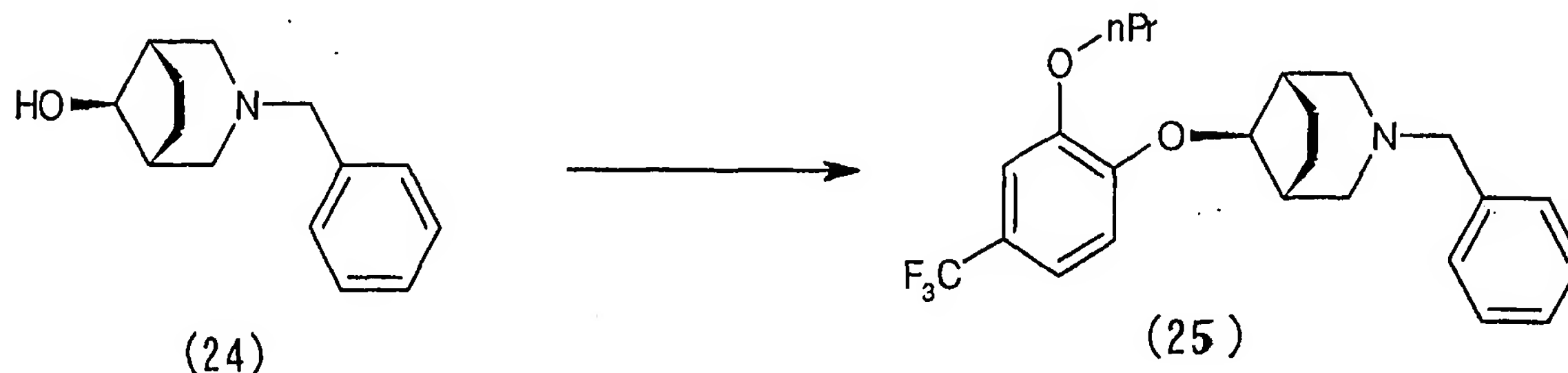
製造例 13

8 β - [2 - プロポキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 3 - [5

ー（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］－３－アザビシクロ〔３．２．１〕
オクタン（化合物番号５－９７）の製造

工程 1

N－ベンジル－８β－〔２－プロポキシ－４－（トリフルオロメチル）フェノキシ〕－３－アザビシクロ〔３．２．１〕オクタン（２５）の製造



N－ベンジル－３－アザビシクロ〔３．２．１〕オクタン－８β－オール（２４）は、J. Med. Chem. 2003, 46, 1456－1464に記載された方法で合成した。

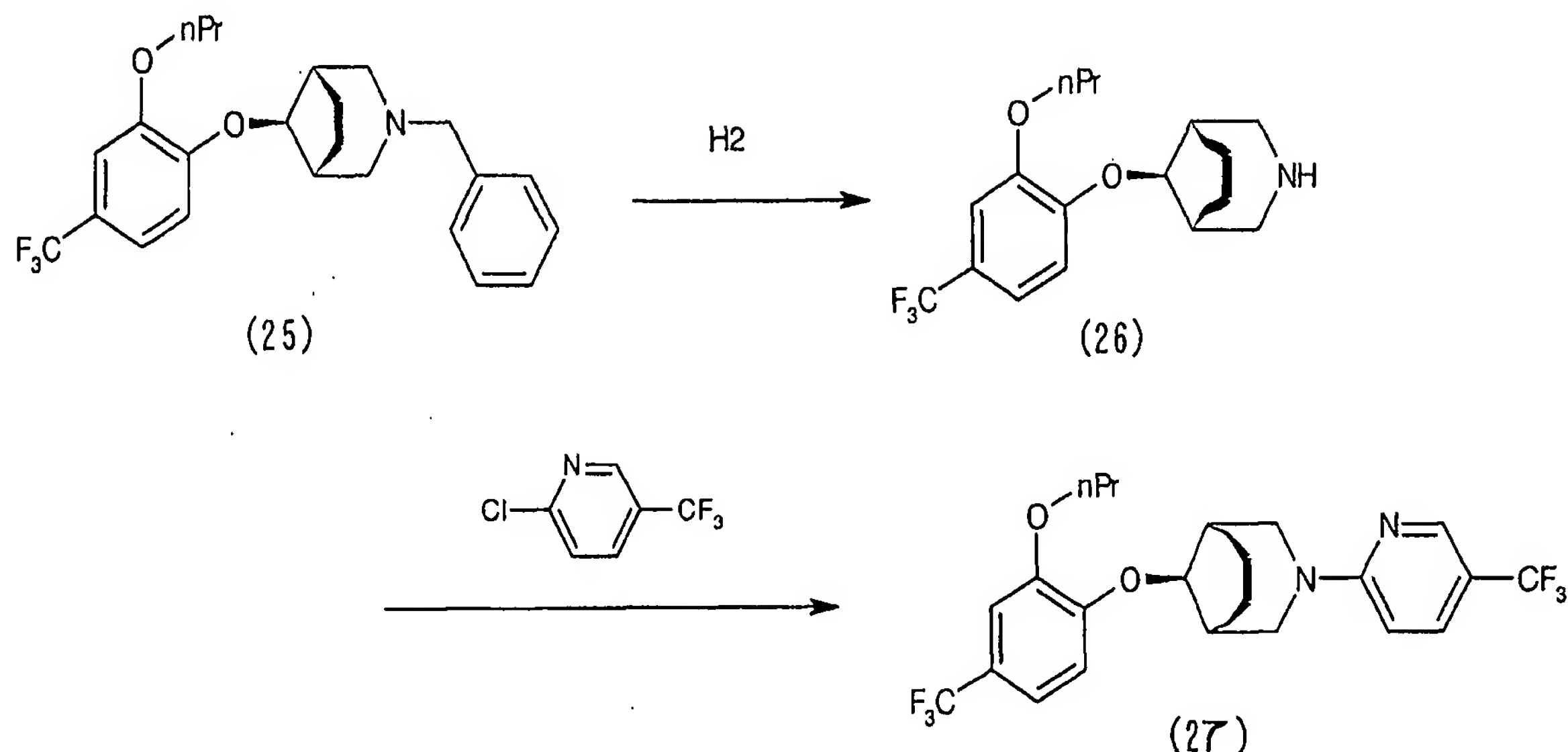
４－フルオロ－３－ヒドロキシベンゾトリフルオリド（０．５０ｇ）のDMF（４ml）溶液に、氷冷下、６０％水素化ナトリウム（０．１２g）を加えた。混合物を室温下３０分間攪拌した後、１－ヨードプロパン（０．５１ｇ）を加えた。混合物を９０℃に昇温して３０分間攪拌した。混合物に（２４）（０．４１ｇ）のDMF（４ml）溶液と６０％水素化ナトリウム（０．０９g）を室温で加え、１５分間攪拌した後、１００℃に昇温して２時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の（２５）（０．７５ｇ）を得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.05 (t, 3H), 1.75－1.91 (m, 6H), 2.19 (d, 2H), 2.34 (br s, 2H), 2.74 (d, 2H), 3.51 (s, 2H), 3.96 (t, 2H), 4.33 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20－7.34 (m, 5H)

工程 2

８β－〔２－プロポキシ－４－（トリフルオロメチル）フェノキシ〕－３－〔５

ー（トリフルオロメチル）ー２ーピリジル］ー３ーアザビシクロ〔３．２．１〕
オクタンの製造



化合物 (25) (0.66 g) のエタノール (20 ml) 溶液に、10%パラジウムー炭素 (0.13 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で一晩攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の化合物 (26) (0.55 g) を得た。

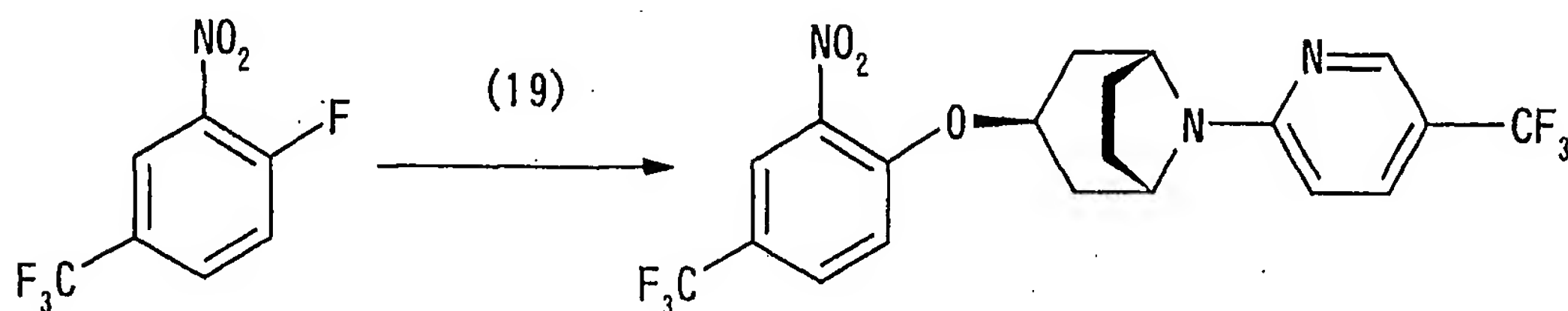
粗製の化合物 (26) (0.55 g) のアセトニトリル (12 ml) 溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (0.57 g) と炭酸カリウム (0.66 g) を加え、混合物を22時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.26 g) を得た。

mp. 48–50°C

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.06 (t, 3H), 1.57–1.63 (m, 2H), 1.85 (sext, 2H), 2.03–2.06 (m, 2H), 2.57 (br s, 2H), 3.08 (d, 2H), 3.98 (t, 2H), 4.15 (d, 2H), 4.63 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

製造例 1 4

3 α - [2 - ニトロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 8 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 8 - アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン (化合物番号 2 - 3 5) の製造



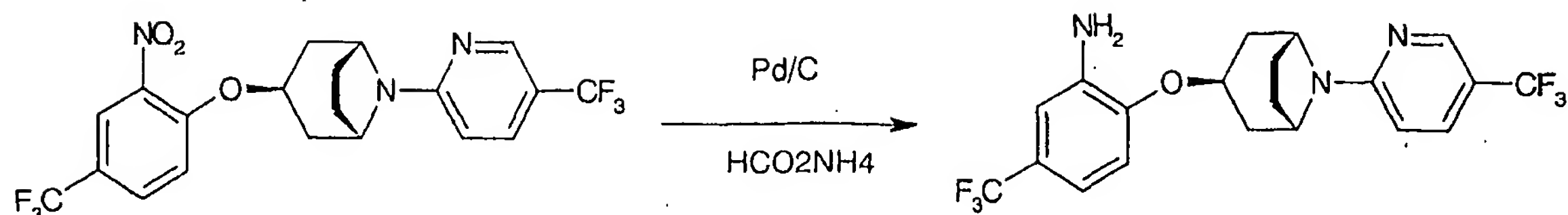
製造例 1 1、工程 2 で得られた化合物 (1 9) (5 g) の DMF (5 0 m l) 溶液に、氷冷下、6 0 % 水素化ナトリウム (0. 8 1 g) を加えた。混合物を室温で 3 0 分間攪拌した後、4 - フルオロ - 3 - ニトロベンゾトリフルオリド (3. 8 4 g) を加えた。混合物を室温で 1 時間攪拌した後、1 0 0 °C に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (4. 9 5 g) を得た。

viscous oil

^1H NMR (CDCl₃) δ 2. 0 1 - 2. 3 6 (m, 8 H), 4. 5 9 (br s, 2 H), 4. 7 5 (t, 1 H), 6. 5 8 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 6 3 (d, 1 H), 7. 7 6 (d, 1 H), 8. 1 2 (s, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

実施例 1 5

3 α - [2 - アミノ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 8 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 8 - アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン (化合物番号 2 - 1 5 8) の製造



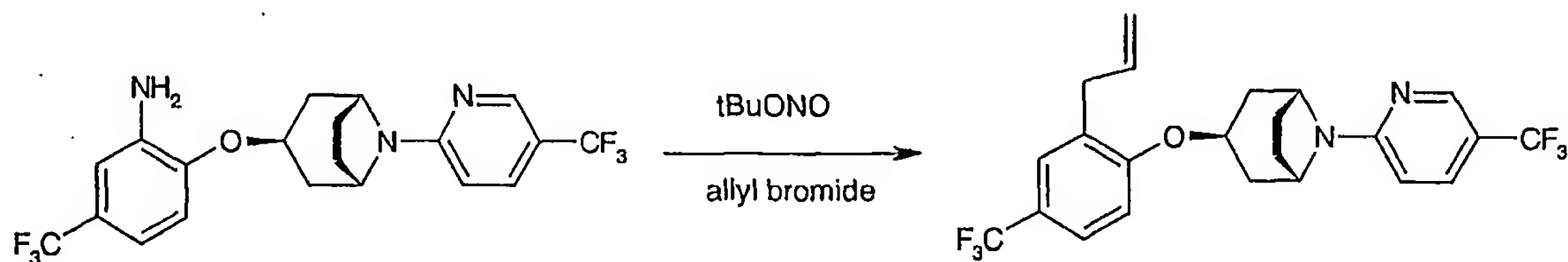
実施例 14 で得られた化合物番号 2-35 (2.14 g) のメタノール (24 ml) 溶液に、10%パラジウム-炭素 (0.21 g) とギ酸アンモニウム (1.43 g) を加えた。混合物を室温で 1 時間攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (1.86 g) を得た。

mp. 87-89 °C

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.03-2.30 (m, 8H), 3.95 (s, 2H), 4.59-4.64 (m, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

製造例 16

3 α -[2-アリル-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (化合物番号 2-62) の製造 (化合物番号 2-62)



以下の反応は、J. Org. Chem., 2002, 67, 6376-6381 に記載された方法に従った。

窒素雰囲気下、亜硝酸 t-ブチル (0.18 g)、臭化アリル (2.1 g) のアセトニトリル (7.5 ml) 溶液に、室温で、実施例 15 で得られた化合物番号 2-158 (0.5 g) を少量ずつ加えた。混合物を室温で 3 時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精

製し、標記化合物（76mg）を得た。

viscous oil

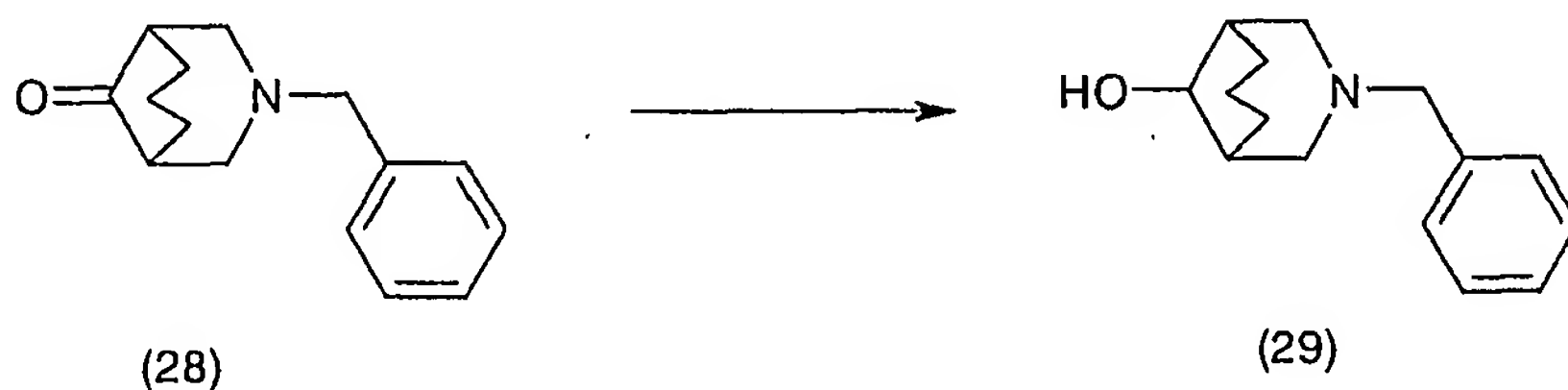
^1H NMR (CDCl₃) δ 1.99–2.33 (m, 8H), 3.46 (d, 2H), 4.58 (brs, 3H), 5.08–5.15 (m, 2H), 5.94–6.07 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.42 (brs, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

実施例 17

9-β-[2-メトキシメトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-3-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-アザビシクロ[3.3.1]ノナン（化合物番号7-100）の製造

工程 1

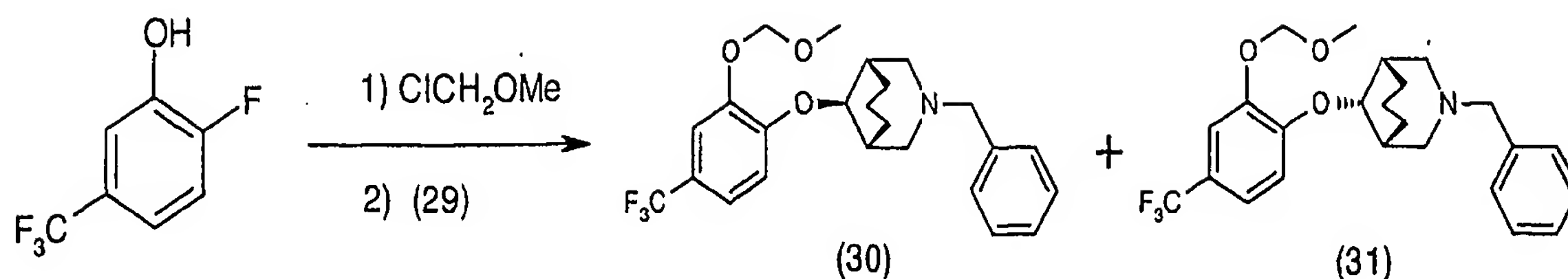
N-ベンジル-3-アザビシクロ[3.3.1]ノナン-9-オール（29）の製造



N-ベンジル-3-アザビシクロ[3.3.1]ノナン-9-オン（28）は、J. Med. Chem. 1994, 37, 2831–2840に記載された方法で合成した。（28）（6.75g）のMeOH（80ml）溶液に、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム（1.49g）を加えた。混合物を氷冷下1時間攪拌した後、溶媒を減圧留去した。残渣に水を加えて、塩化メチレンで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の（29）（6.52g）を得た。

工程 2

9-[2-メトキシメトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-3-ベンジル-3-アザビシクロ[3.3.1]ノナン（30）,（31）の製造



4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (7.49 g) のDMF (75 ml) 溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム (1.77 g) を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル (3.57 g) を滴下した。混合物を室温に昇温して30分間攪拌し、さらに80℃に昇温して30分間攪拌した。混合物に化合物 (29) (6.4 g) と60%水素化ナトリウム (1.33 g) を室温で加え、30分間攪拌した後、100℃に昇温して3時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (30) (6.3 g) と化合物 (31) (4.25 g) を得た。

(0.56 g) を得た。

化合物 (30): v i s c o u s o i l

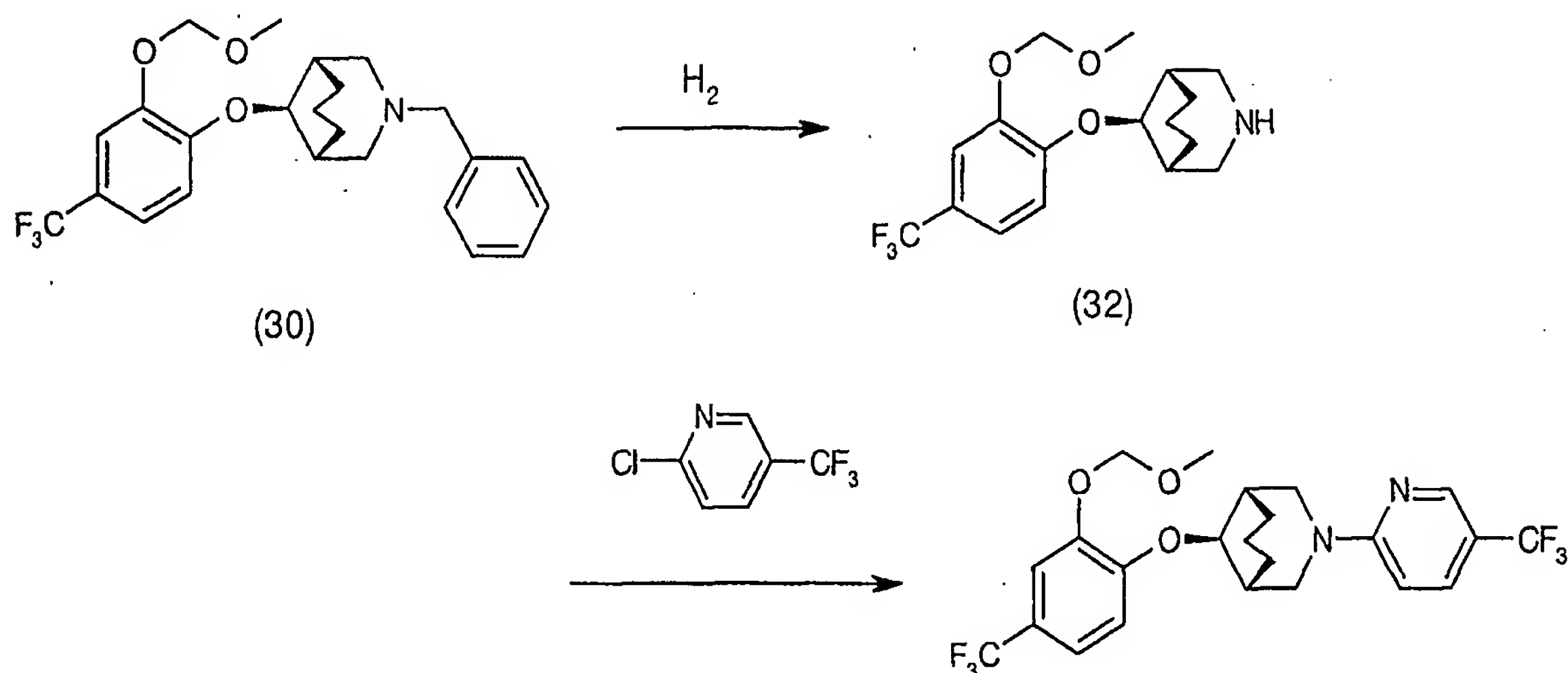
¹H NMR (CDCl₃) δ 1.43-1.60 (m, 3H), 2.01-2.08 (m, 4H), 2.36 (d, 2H), 2.65-2.80 (m, 1H), 3.02 (d, 2H), 3.42 (s, 2H), 3.53 (s, 3H), 4.35 (br s, 1H), 5.23 (s, 2H), 6.93 (d, 1H), 7.21-7.33 (m, 8H)

化合物 (31): v i s c o u s o i l

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.46-1.55 (m, 1H), 1.68-1.80 (m, 2H), 1.91-1.97 (m, 2H), 2.09 (brd, 3H), 2.68-2.82 (s plus m, 5H), 3.41 (s, 2H), 3.54 (s, 3H), 4.31 (t, 1H), 5.22 (s, 2H), 6.92 (d, 1H), 7.20-7.33 (m, 8H)

工程 3

9β-[2-メトキシメトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-3-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-アザビスクロ[3.3.1]ノナン(化合物番号7-100)の製造



化合物(30)(6.11g)のエタノール(180ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(1.22g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で1時間、さらに80℃に昇温して7時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の(32)(4.54g)を得た。

粗製の化合物(32)(4.54g)のアセトニトリル(180ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(11.92g)と炭酸カリウム(10.9g)を加え、混合物を一晩加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(2.61g)を得た。

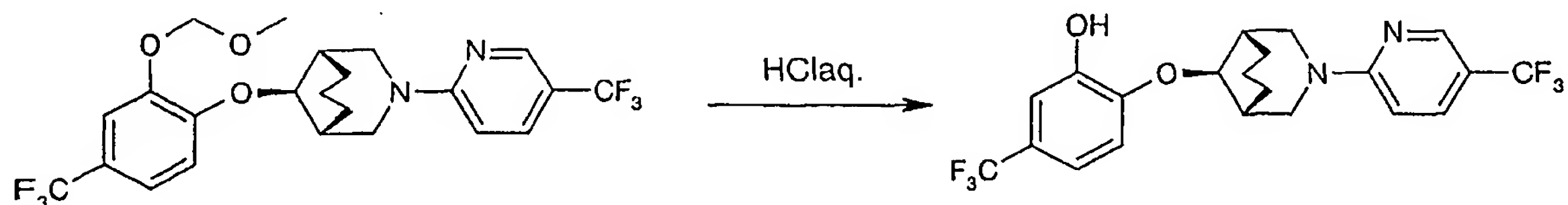
viscous oil.

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.44-1.69 (m, 3H), 1.74-1.91 (m, 1H), 2.08-2.21 (m, 2H), 2.32 (br s, 2H), 3.28 (d, 2H), 3.54 (s, 3H), 4.47 (d, 2H), 4.62 (t, 1H), 5.25 (s, 2H), 6.66 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s,

1 H)

実施例 18

9β-[2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-3-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-アザビスクロ[3.3.1]ノナン(化合物番号7-4)の製造



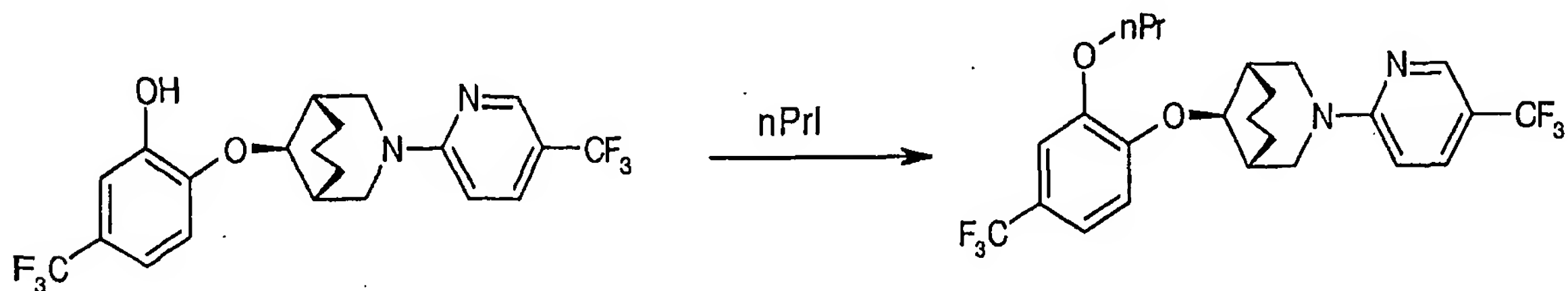
製造例 17 で得られた(化合物番号7-100)(2.54 g)を用いて、実施例 7 と同様の方法により、標記化合物(2.12 g)を得た

mp. 108-110℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.46-1.54 (m, 1H), 1.71-1.78 (m, 2H), 1.82-1.93 (m, 1H), 1.98-2.07 (m, 2H), 2.37 (b.r.s, 2H), 3.31 (d, 2H), 4.51 (d, 2H), 4.70 (t, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.15-7.29 (m, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.43 (s, 1H)

製造例 19

9β-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-3-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-アザビスクロ[3.3.1]ノナン(化合物番号7-82)の製造



実施例 18 で得られた(化合物番号7-4)(0.3 g)のDMF(15 ml)

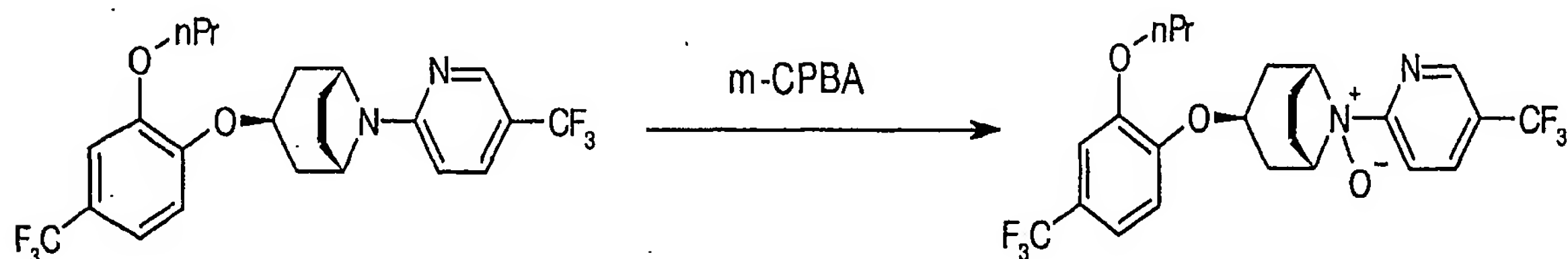
溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.03g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、氷冷下、1-ヨードプロパン(0.13g)を加えて、室温下30分間攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.27g)を得た。

viscous oil.

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.09 (t, 3H), 1.45-1.49 (m, 3H), 1.55-1.93 (m, 3H), 2.16-2.30 (m, 4H), 3.25 (d, 2H), 4.00 (t, 2H), 4.45 (d, 2H), 4.61 (s, 1H), 6.65 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.12-7.24 (m, 2H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

実施例20

3 α -[2-プロポシキ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-オキシ-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(化合物番号2-84)の製造



実施例12で得られた(化合物番号2-82)(0.48g)の塩化メチレン(5ml)溶液に、メタクロロ過安息香酸混合物(純度65%、0.28g)を室温で加えた。2時間加熱還流した後、混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液および飽和食塩水で1回ずつ洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.28g)を得た。

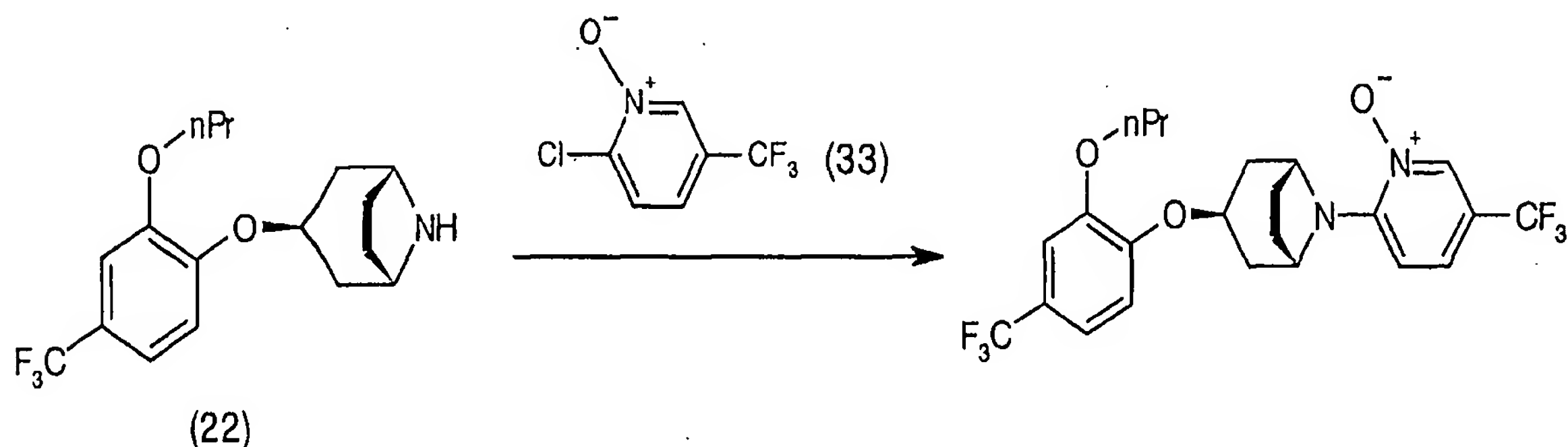
mp. 129-130°C

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.09 (t, 3H), 1.82-1.94 (m, 2H), 2.20-2.41 (m, 8H), 3.77 (br s, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.54 (t, 1H), 6.81 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.

1.5 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 8.48 (s, 1H)

実施例 2 1

3- α -[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル-1-オキシ]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (化合物番号 2-83) の製造



ピリジンN-オキシド (33) は、J. Heterocycl. Chem. 1976, 13, 41-42に記載された方法で合成した。実施例 13で得られた (22) (0.65 g) のアセトニトリル (6 ml) 懸濁液に、ピリジンN-オキシド (33) (0.395 g) と炭酸カリウム (0.82 g) を加え、混合物を8時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮し、標記化合物 (0.88 g) を得た。

mp. 143-145°C

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.08 (t, 3H), 1.83-1.90 (m, 2H), 2.04-2.15 (m, 4H), 2.25-2.31 (m, 2H), 2.44-2.48 (m, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.68 (br s, 1H), 5.02 (br s, 2H), 6.79-6.84 (m, 2H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.23-7.33 (m, 1H), 8.39 (s, 1H)

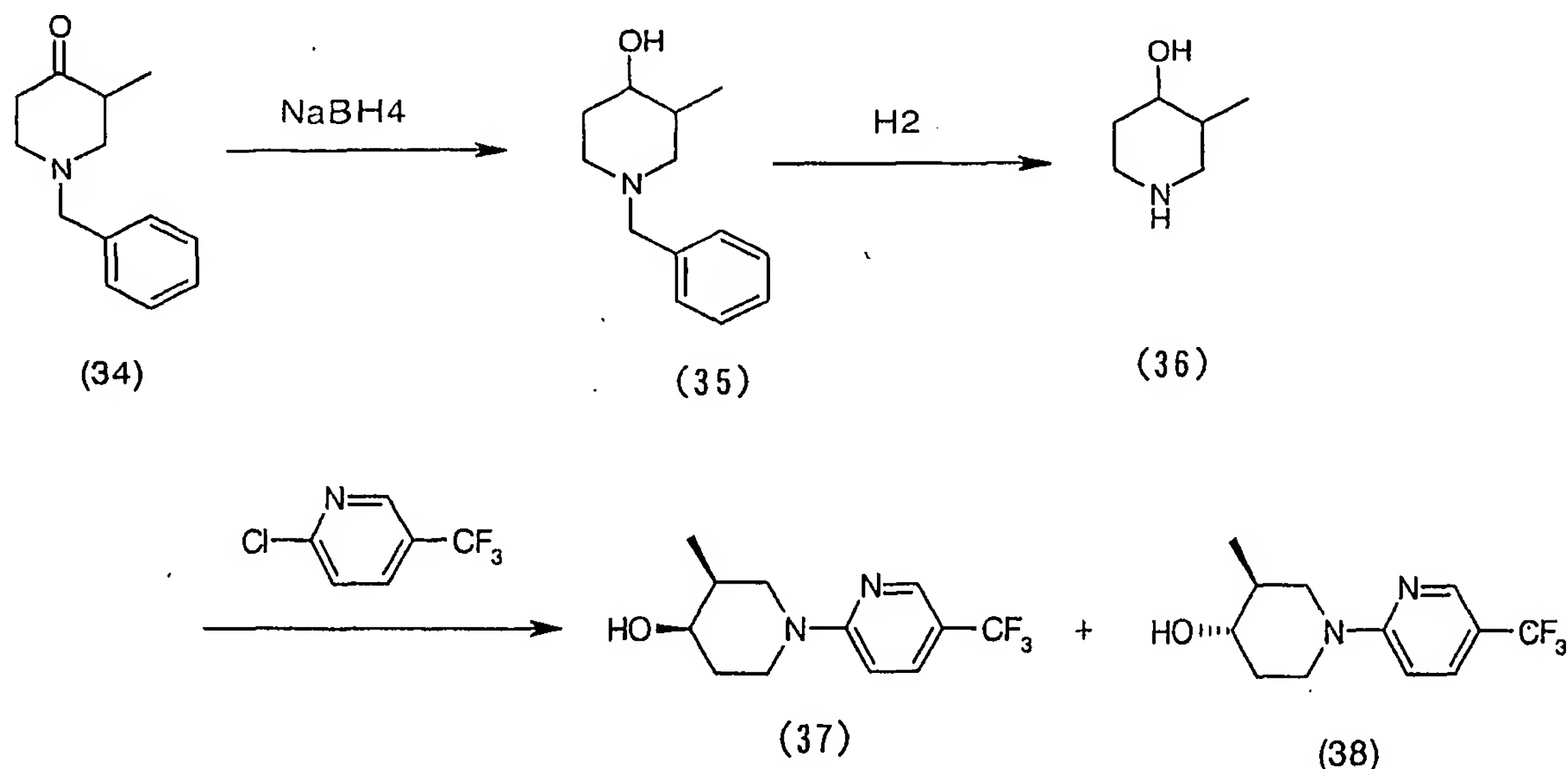
実施例 2 2

シス-3-メチル-4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン (化合物

番号 1-97) の製造

工程 1

シス-3-メチル-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-4-ピペリジノール (35) およびトランス-3-メチル-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-4-ピペリジノール (36) の製造



N-ベンジル-3-メチル-4-ピペリジノン (34) は、文献既知化合物 (C A S. n o. [34737-89-8]) で、市販品もある。化合物 (34) (2.53 g) の E t O H (40 m l) 溶液に、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (0.47 g) を加えた。混合物を室温下 2 時間攪拌した後、氷冷下、10% 塩酸で中和した。混合物を塩化メチレンで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の (35) (2.27 g) を得て、そのまま次の反応に用いた。

粗製の (35) (1.82 g) のメタノール (30 m l) 溶液に、20% 水酸化パラジウム-炭素 (0.2 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、70℃ に昇温して 1 昼夜攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液に 20% 水酸化パラジウム-炭素 (0.9 g) を加え、70℃ に昇温して 1 晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の (36) (1.22 g) を得て、そのまま次の反応に用いた。

粗製の化合物 (36) (1.22 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (2.3 g) と炭酸カリウム (4.4 g) を加え、混合物を一晩加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (37) (0.15 g) および (38) (0.55 g) を得た。

(37): 黄色油状

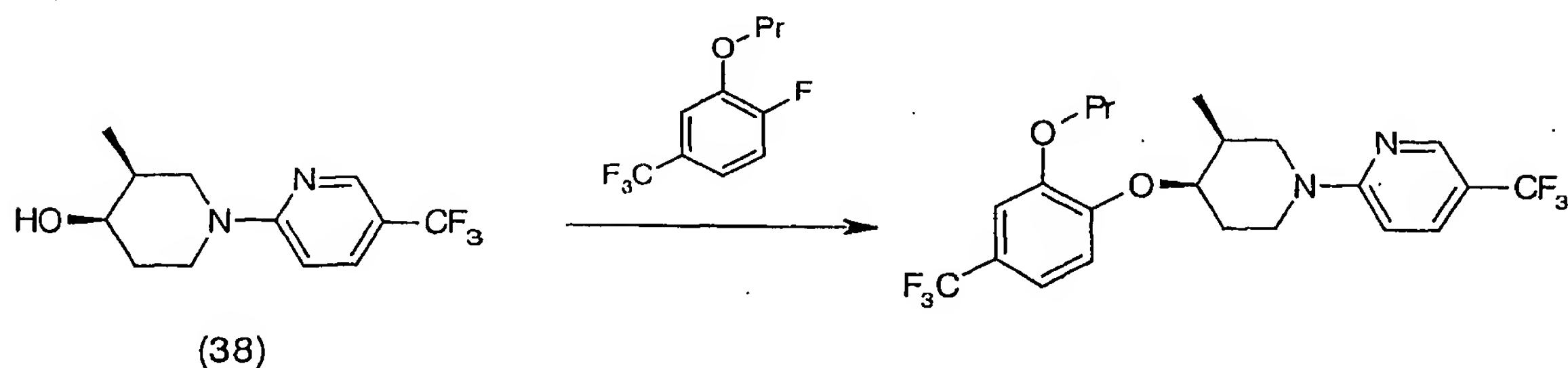
^1H NMR (CDCl₃) δ 1.01 (d, 3H), 1.59 (br s, 1H), 1.77–1.94 (m, 3H), 3.21 (t, 1H), 3.44–3.53 (m, 1H), 3.85–3.98 (m, 3H), 6.65 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

(38): 黄色油状

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.07 (d, 3H), 1.46–1.63 (m, 3H), 2.00–2.07 (m, 1H), 2.65 (t, 1H), 3.02 (t, 1H), 3.40–3.47 (m, 1H), 4.26–4.40 (m, 2H), 6.66 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

工程 2

シス-3-メチル-4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン (化合物番号 1-97) の製造



化合物 (38) (0.15 g) の DMF (4 ml) 溶液に、60% 水素化ナトリウム (0.023 g) を室温で加えた。混合物を 70℃ に昇温して 4-フルオロ-3-プロポキシベンゾトリフルオライド (0.14 g) を加え、100℃ で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後、水に注いで、酢酸エチルで抽出し

た。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.18 g) を得た。

$n_D^{22.8}$ 1.5000

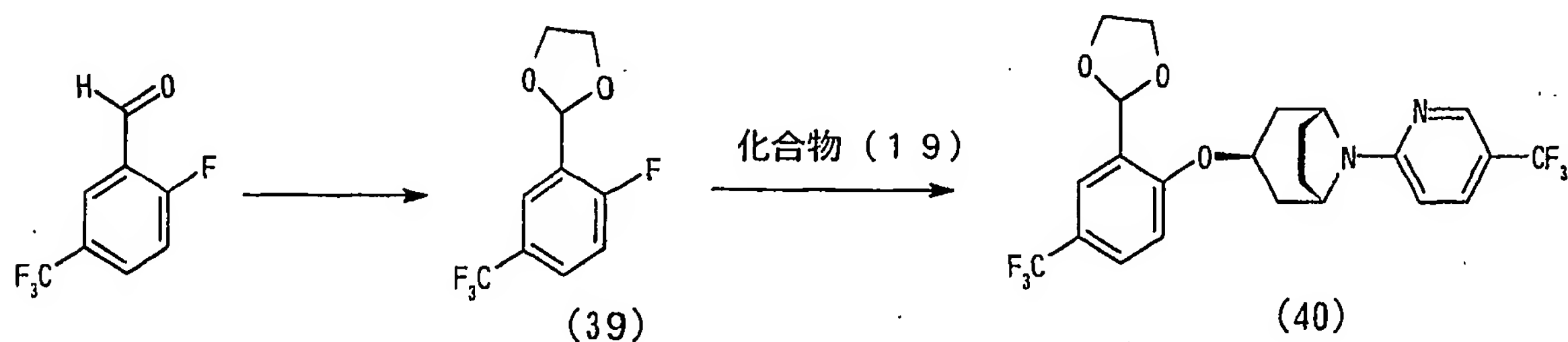
^1H NMR (CDCl₃) δ 1.05 (t, 3H), 1.12 (d, 3H), 1.71–1.92 (m, 4H), 2.02–2.08 (m, 2H), 3.40 (t-like, 1H), 3.51 (t-like, 1H), 3.95–4.05 (m, 3H), 4.55 (brs-like, 1H), 6.67 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

製造例 23

3 α -[2-ブチル-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (化合物番号 2-187) の製造

工程 1

3 α -{2-([1,3]ジオキサラン-5-イル)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ}-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (化合物番号 2-169) の製造



2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド (5.00 g)、エチレングリコール (1.78 g) および p-トルエンスルホン酸一水和物 (0.49 g) のベンゼン (50 ml) 溶液を一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、溶媒を留去することにより、粗製の化合物 (39) (5.81 g) を得た。

粗製の (39) (2.00 g) および化合物 (19) (2.30 g) の DMF (2

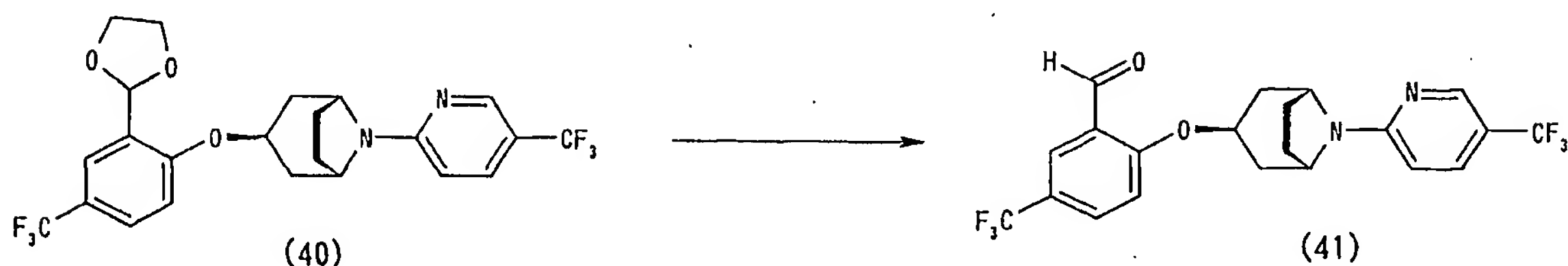
0 ml) 溶液に 80℃ で 60% 水素化ナトリウム (0.50 g) を 5 回に分けて加えた。そのまま混合物を 80℃ で 1 時間攪拌した。室温まで冷却した後、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し、標記化合物 (3.24 g) を得た。

mp. 148–151℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.01–2.14 (m, 4H), 2.24–2.37 (m, 4H), 4.04–4.20 (m, 4H), 4.58 (br s, 2H), 4.63 (t, 1H), 6.17 (s, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.75 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.84 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程 2

3 α -[2-ホルミル-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(41)の製造



化合物 (40) (3.24 g) の THF (100 ml) 溶液に 6 規定塩酸 (100 ml) を氷冷下加えた。混合物を室温まで昇温し、2 時間攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を 10% 炭酸ナトリウム水溶液および食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (2.95 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.04–2.39 (m, 8H), 4.64 (br s, 2H), 4.78 (t, 1H), 6.60 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.65 (dd, 1H), 7.77 (dd, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 10.53 (s, 1H)

工程 3

3 α -[2-(1-ヒドロキシブチル)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビスクロ[3.2.1]オクタン(42)の製造



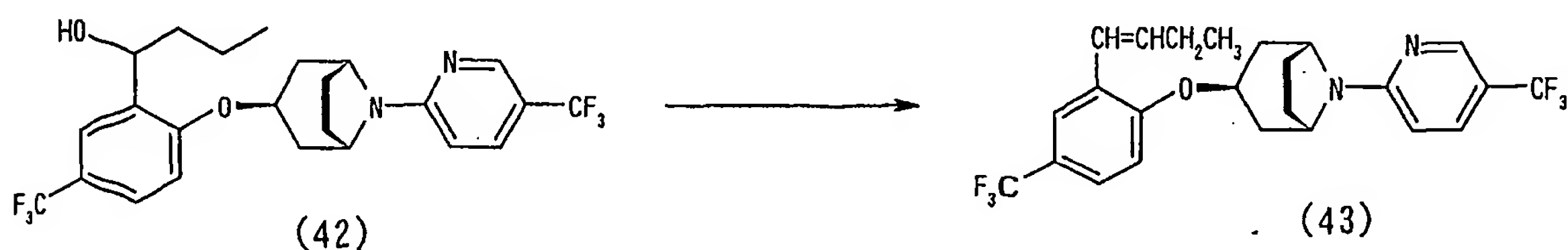
化合物(41)(1.83g)のTHF溶液に窒素雰囲気下、0℃でn-プロピルマグネシウムブロミドのTHF溶液(1.02mol/l)(6.06ml)を滴下し、その後、室温まで昇温し、2時間攪拌した。混合液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(42)(0.96g)を得た。

mp. 141-145℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 0.98 (t, 3H), 1.41-1.60 (m, 2H), 1.71-1.81 (m, 2H), 1.98-2.04 (m, 3H), 2.16-2.37 (m, 5H), 4.59-4.62 (m, 3H), 5.09-5.14 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程 4

3 α -[2-(ブチ-1-イル)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビスクロ[3.2.1]オクタン(42)の製造



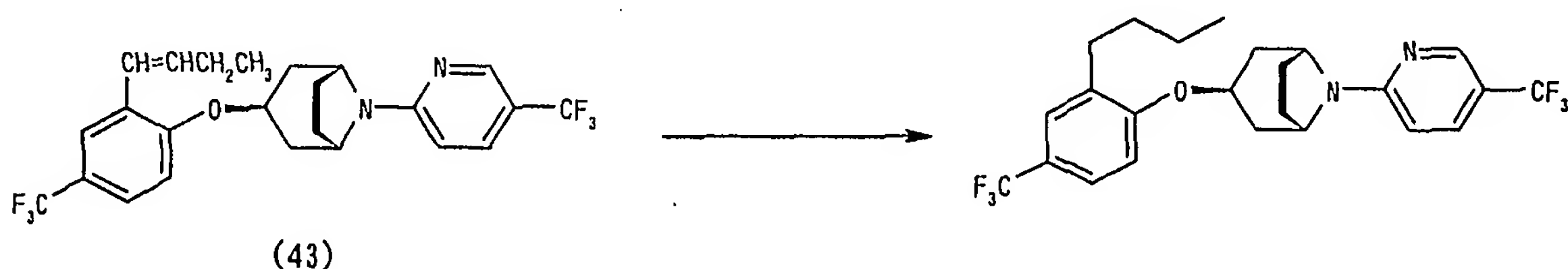
化合物 (42) (0.40 g) および p-トルエンスルホン酸一水和物 (0.14 g) のトルエン (4 ml) 溶液を一晩加熱還流した。混合液を室温まで冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し、標記化合物 (43) (0.37 g) を得た。

mp. 94–98 °C

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.14 (t, 3H), 2.00–2.32 (m, 10H), 4.58–4.63 (m, 3H), 6.26–6.35 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.69–6.77 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程 5

3 α -[2-ブチル-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタンの製造



化合物 (43) (0.22 g) のエタノール (6 ml) 溶液に 5% パラジウム-炭素 (0.04 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で一晩攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記の化合物 (0.18 g) を得た。

mp. 86–88 °C

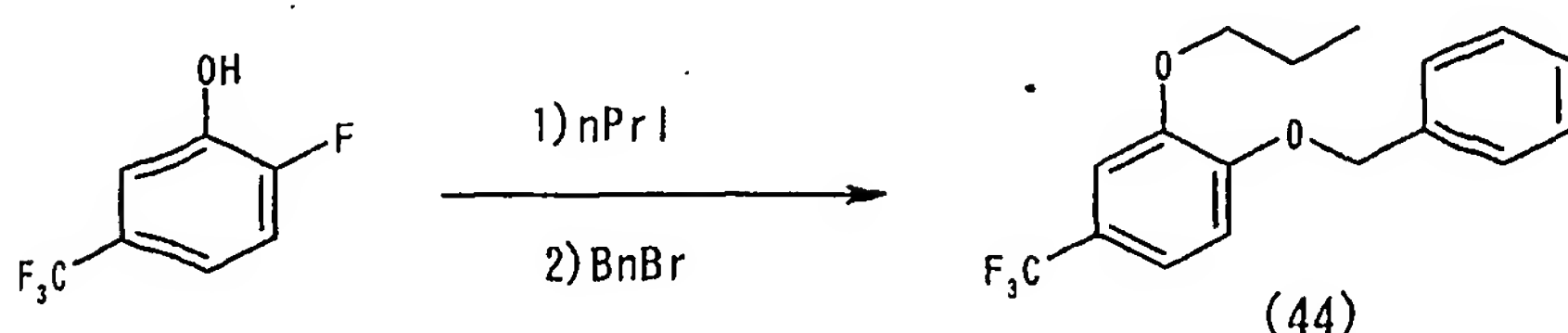
^1H NMR (CDCl₃) δ 0.96 (t, 3H), 1.35–1.47 (m, 2H), 1.54–1.66 (m, 2H), 1.97–2.03 (m, 2H), 2.10–2.14 (m, 2H), 2.21–2.32 (m, 4H), 2.64 (t, 2H), 4.54–4.56 (m, 3H), 6.51 (d, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.56 (dd, 1H), 8.31 (s, 1H)

製造例 24

4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェニルスルファニル]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン (化合物番号 9-94) の製造

工程 1

1-ベンジルオキシ-2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)ベンゼン (44) の製造

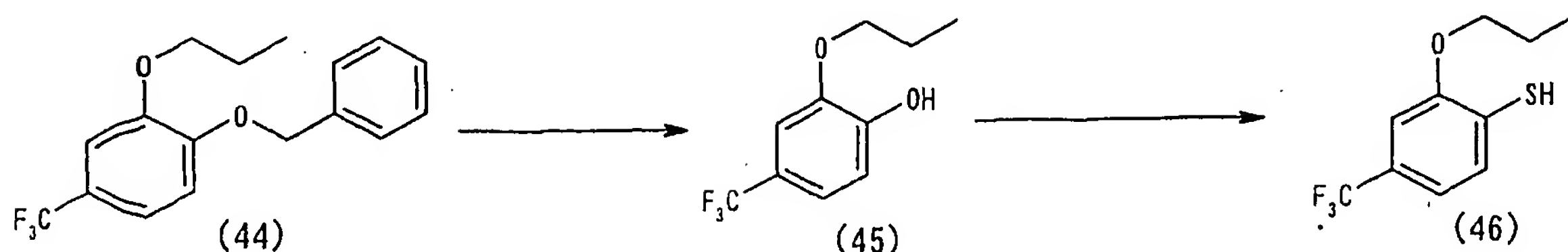


4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (1.80 g) の DMF (20 ml) 溶液に、氷冷下 60% 水素化ナトリウム (0.44 g) を加え、混合物を室温まで昇温して 30 分間攪拌した後、1-ヨードプロパン (1.87 g) の DMF (5 ml) 溶液を加えた。混合物を 80℃ まで昇温させ、30 分間攪拌した。混合物を室温まで冷却した後に、ベンジルアルコール (2.16 g) と 60% 水素化ナトリウムを加え、80℃ に昇温して 30 分間攪拌した。混合液を室温まで冷却し、氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (44) (2.95 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.07 (t, 3H), 1.82–1.94 (m, 2H), 4.00 (t, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.92 (d, 1H), 7.09–7.14 (m, 2H), 7.28–7.44 (m, 5H)

工程 2

2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンチオール (46) の製造



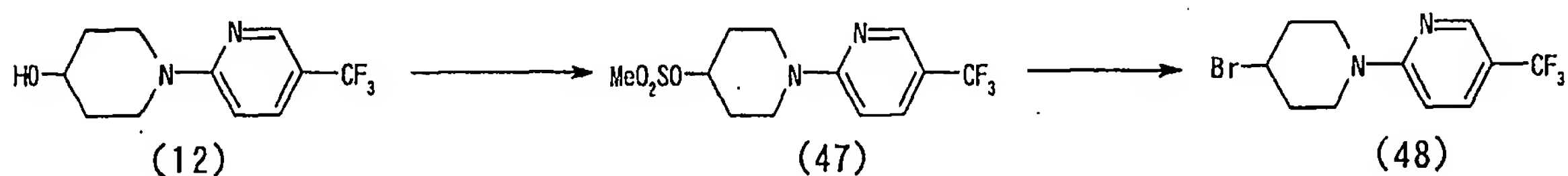
化合物(44)(2.95 g)のエタノール溶液に、10%パラジウム-炭素(0.59 g)を加え、懸濁液を水素雰囲気下、室温で一晩撹拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(45)(2.01 g)を得た。

粗製の化合物(45)(2.01 g)から、J. Med. Chem. 2002, 45, 3972-3983.に記載された方法により、標記化合物(46)(1.82 g)を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.10 (t, 3H), 1.84-1.96 (m, 2H), 4.07 (t, 2H), 7.01 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 7.32 (d, 1H)

工程 3

4-ブロロ-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジン(48)の製造



化合物(12)(1.00 g)のアセトニトリル(10 ml)溶液に、氷冷下、トリエチルアミン(0.45 g)とメタンスルホニルクロライド(0.51 g)を加え、混合物を室温まで昇温した。30分間撹拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮することにより、粗製の(47)(1.32 g)を得た。

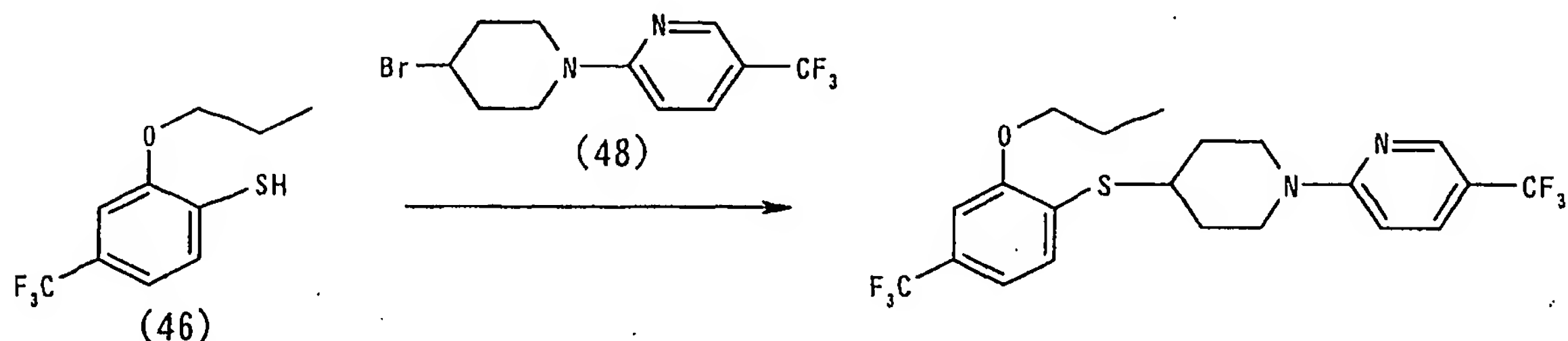
粗製の化合物(47)(1.32 g)のDMF(13 ml)溶液に、臭化リチウム(1.06 g)を加え、混合物を80℃で1時間撹拌した。混合物を冷却した後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮することにより、粗製の(48)(1.32 g)を得た。

ウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し、標記化合物 (48) (0.74 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.99–2.10 (m, 2H), 2.16–2.25 (m, 2H), 3.55–3.62 (m, 2H), 3.91–4.00 (m, 2H), 4.42–4.49 (m, 1H), 6.66 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

工程 4

4-[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェニルスルファニル]-1-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]ピペリジンの製造



化合物 (46) (0.62 g) の DMF (7 ml) 溶液に、氷冷下 60% 水素化ナトリウムを加え、室温に昇温させ、30 分間攪拌した。混合物に化合物 (48) (0.74 g) を加え、100℃に昇温し、一時間攪拌した。混合物を冷却した後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.90 g) を得た。

Viscous oil

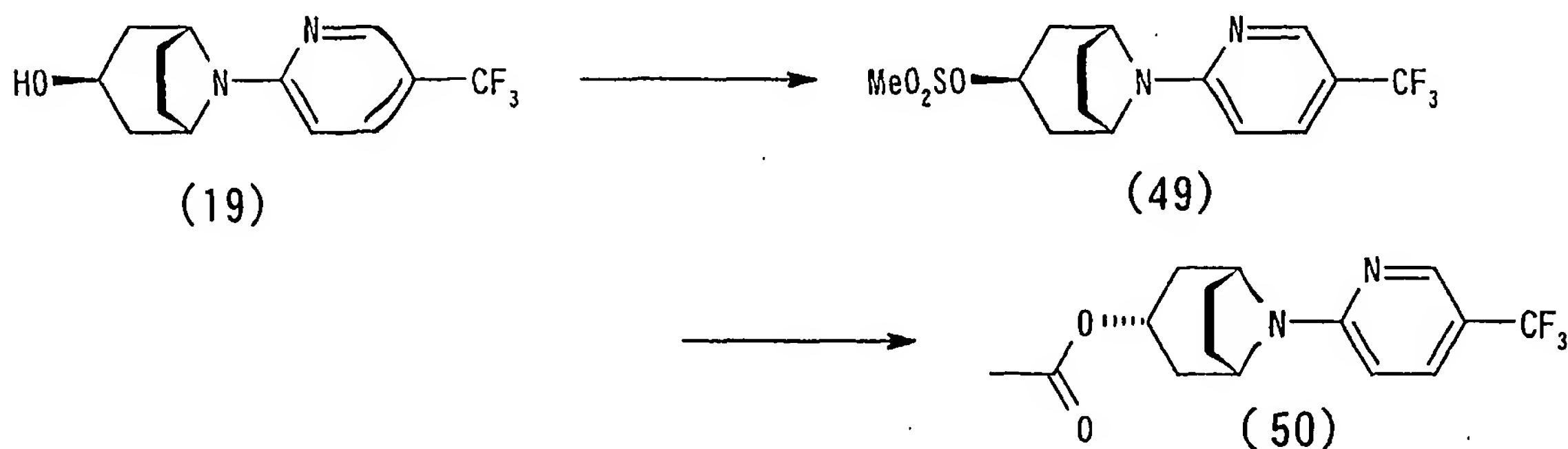
^1H NMR (CDCl₃) δ 1.09 (t, 3H), 1.63–1.75 (m, 2H), 1.84–1.95 (m, 2H), 2.04–2.10 (m, 2H), 3.19–3.28 (m, 2H), 3.54–3.62 (m, 1H), 4.03 (t, 2H), 4.21–4.28 (m, 2H), 6.64 (d, 1H), 7.04 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.38 (s, 1H)

製造例 25

3 α -[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェニルスルファニル]-
8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.
1]オクタンの製造

工程 1

3 β -アセトキシ-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (50) の製造



化合物 (19) (2.00 g) の塩化メチレン (20 ml) 溶液に氷冷下、トリエチルアミン (1.12 g) とメタンスルホニルクロライド (1.26 g) を加え、30 分間攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の化合物 (49) (2.29 g) を得た。

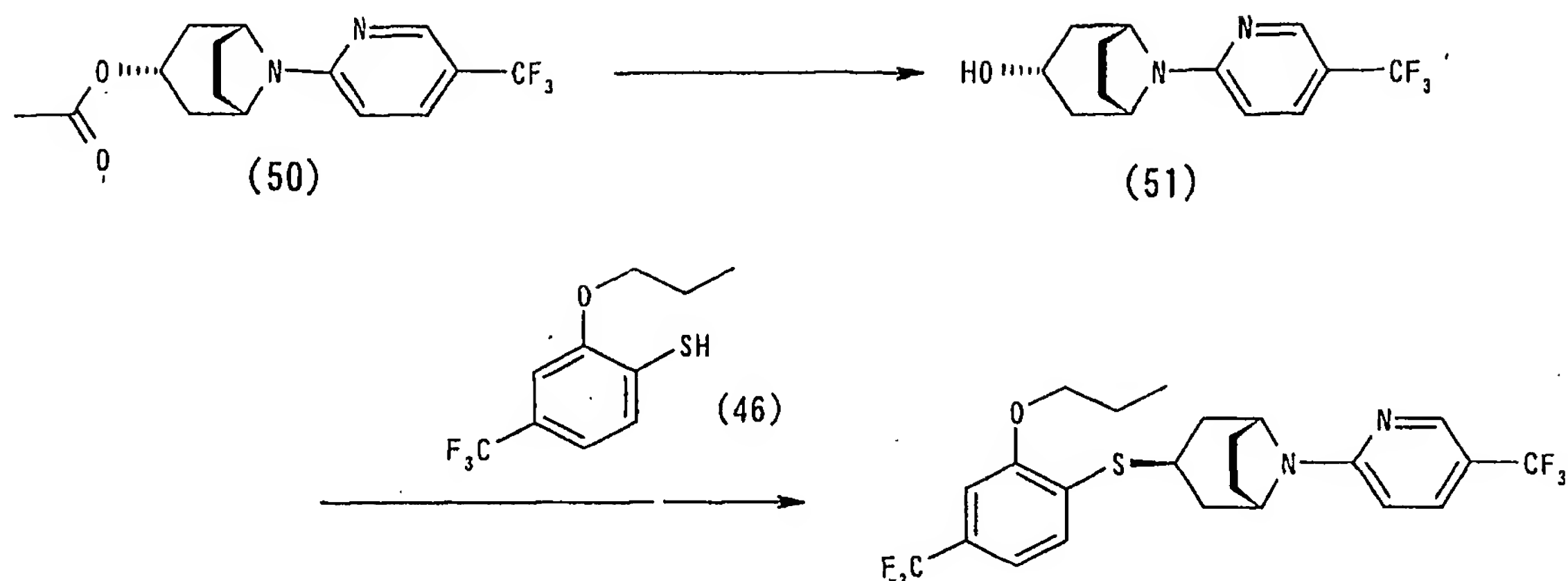
粗製の化合物 (49) (2.29 g) の DMF (35 ml) 溶液に酢酸セシウム (1.88 g) を加え、100℃ に昇温し、一晩攪拌した。混合物を室温まで冷却した後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (50) (1.15 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.66–1.75 (m, 2H), 1.87–2.18 (m, 9H), 4.61 (br s, 2H), 5.25–5.36 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程 2

3 α -[2-プロポキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシスルファニル]-
8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.

1] オクタンの製造



化合物 (50) (1.15 g) のメタノール (25 ml) 溶液に 28% ナトリウムメトキシドのメタノール溶液 (0.07 g) を加え、混合物を還流下 2 時間攪拌した。冷却後、メタノールを減圧留去し、水を注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の化合物 (51) (1.00 g) を得た。

粗製の化合物 (51) (1.00 g) と化合物 (46) (0.87 g) のトルエン (10 ml) 溶液にトリフェニルホスフィン (1.93 g) とジイソプロピルアゾジカルボキシレート (1.49 g) を加え、室温で一晩攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.39 g) を得た。

mp. 72–74 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.07 (t, 3H), 1.83–1.92 (m, 4H), 2.13–2.17 (m, 2H), 2.35–2.55 (m, 4H), 3.69 (t, 1H), 4.01 (t, 2H), 4.57 (br s, 2H), 6.51 (d, 1H), 7.02 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 8.38 (d, 1H)

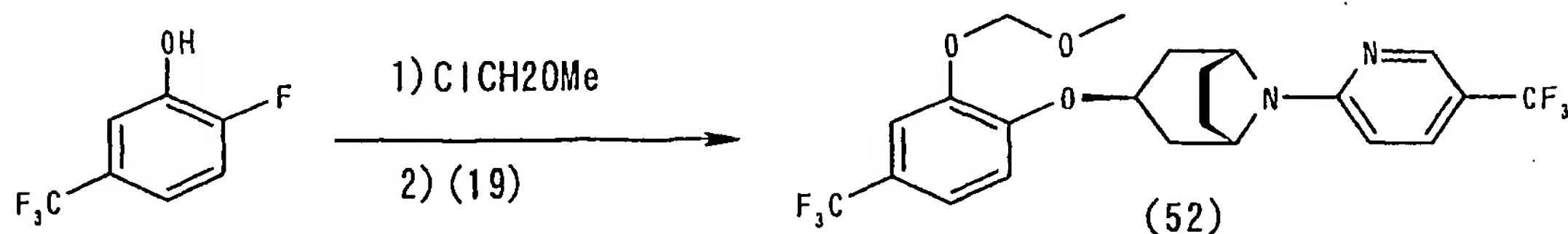
製造例 26

3 α -[2-イソプロピリデンアミノオキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノ

キシ]ー8-[5-(トリフルオロメチル)ー2-ピリジル]ー8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(化合物番号2-212)の製造

工程1

3 α -[2-メトキシメトキシー4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ー8-[5-(トリフルオロメチル)ー2-ピリジル]ー8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(52)の製造



4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(2.48g)のDMF(30ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.59g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル(1.18g)を滴下した。混合物を室温に昇温して30分間攪拌し、さらに80℃に昇温して30分間攪拌した。混合物に化合物(19)(2.50g)と60%水素化ナトリウム(0.55g)を室温で加え、30分間攪拌した後、100℃に昇温して2時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(52)(3.98g)を得た。

mp. 69-73℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.01-2.25 (m, 6H), 2.37-2.44 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 4.57-4.63 (m, 3H), 5.23 (s, 2H), 6.56 (d, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程2

3 α -[2-ヒドロキシー4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ー8-[5-(トリフルオロメチル)ー2-ピリジル]ー8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(5

3) の製造



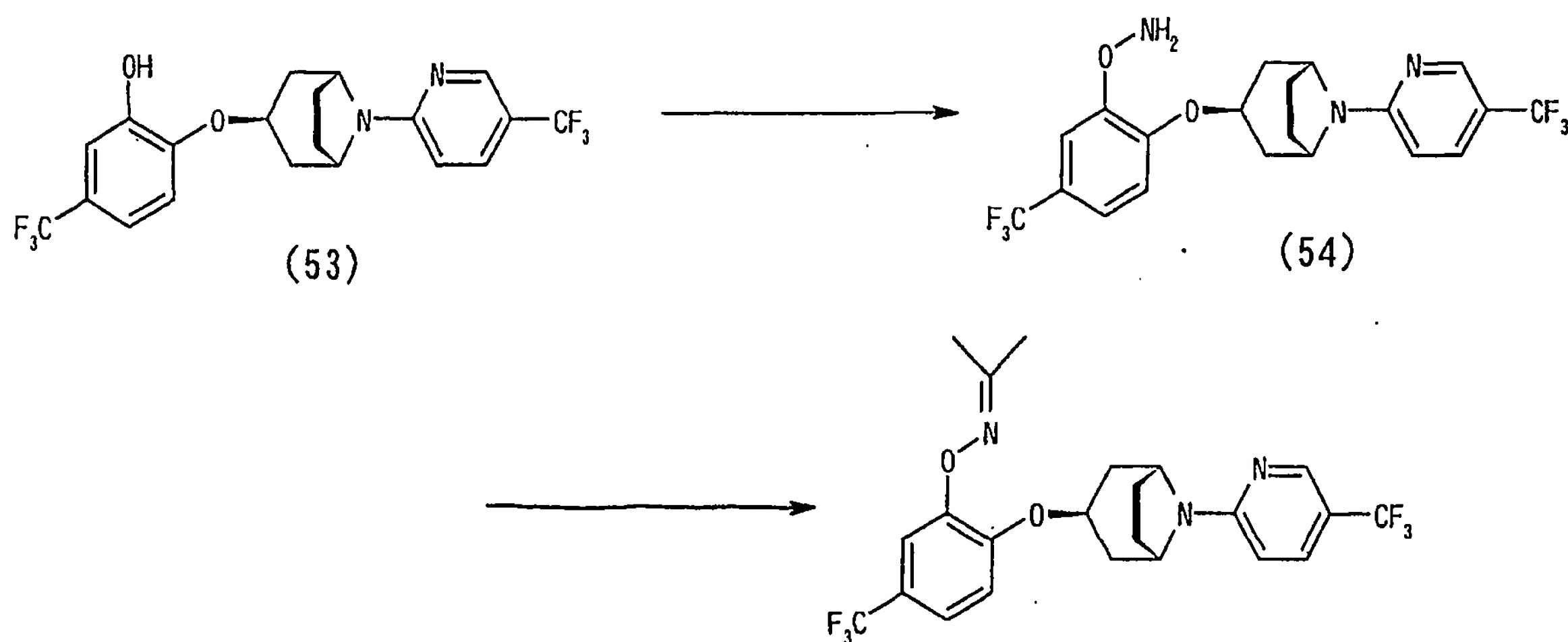
化合物 (N) (3.98 g) を用いて、実施例 7 と同様方法により、標記化合物 (53) (3.61 g) を得た。

mp. 90 – 94 °C

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.03 – 2.34 (m, 8H), 4.61 (br s, 2H), 4.67 (t, 1H), 5.88 (s, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程 3

3 α -[2-イソプロピリデンアミノオキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタンの製造



化合物 (53) (1.00 g) を用いて、特開 2001-81071 号公報に記載された方法により、化合物 (54) (0.54 g) を合成した。

化合物 (54) (0.25 g) のエタノール (2 ml) 溶液にアセトン (1 ml) と濃塩酸 (0.03 g) を加え、室温で 1 時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.20 g) を得た。

mp. 107-109°C

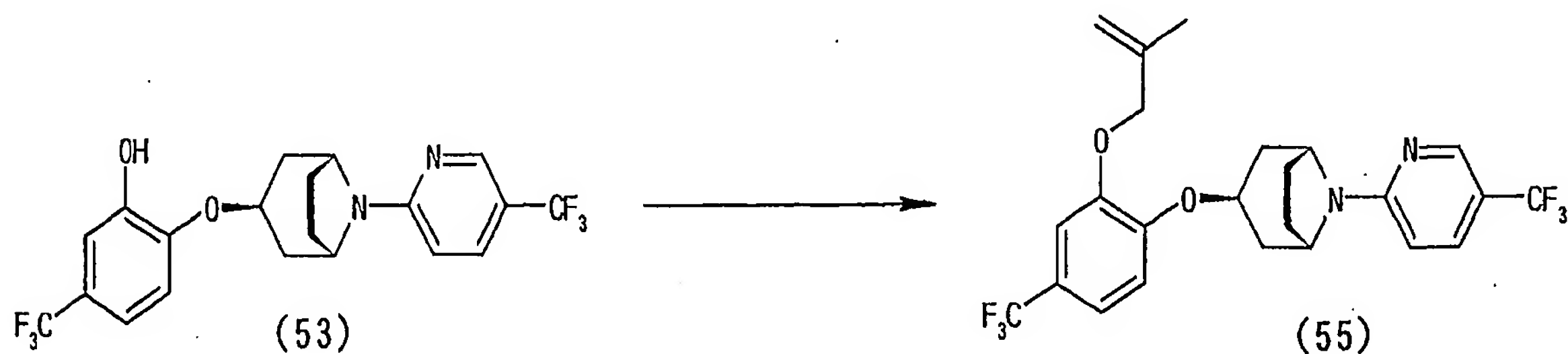
^1H NMR (CDCl₃) δ 2.01-2.28 (m, 12H), 2.40-2.48 (m, 2H), 4.56 (br s, 2H), 4.64 (t, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

製造例 27

3 α -[2-(2-メチルプロペニルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (化合物番号 2-245) の製造

工程 1

3 α -[2-(2-メチルアリルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (55) の製造



化合物 (53) (0.50 g) の DMF (5 ml) 溶液に氷冷下、60% 水素化ナトリウム (0.05 g) を加えた。混合物を室温下 30 分間攪拌した後、氷冷下、メタリルクロライド (0.14 g) とヨウ化ナトリウム (0.23 g) を加

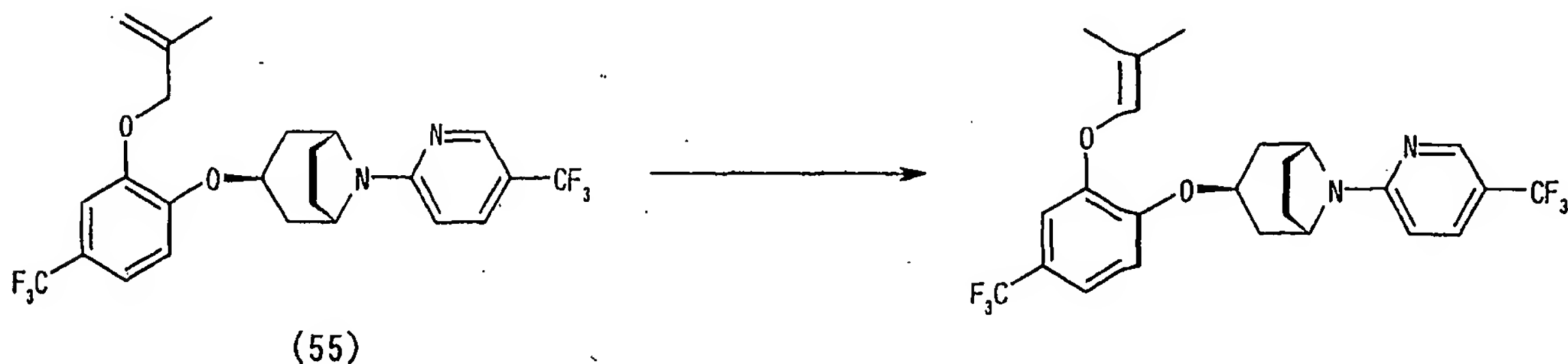
え、混合物を室温に昇温して30分間攪拌し、さらに80℃に昇温して1時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(55)(0.48g)を得た。

mp. 96–98℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.87 (s, 3H), 2.01–2.24 (m, 6H), 2.41–2.47 (m, 2H), 4.47 (s, 2H), 4.56 (br s, 2H), 4.61 (t, 1H), 5.03 (s, 1H), 5.16 (s, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

工程2

3 α -[2-(2-メチルプロペニルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタンの製造



化合物(55)(0.42g)のDMSO溶液にt-ブトキシカリウム(0.11g)を加え、100℃で5時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.19g)を得た。

mp. 90–92℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.73 (d, 6H), 2.01–2.24 (m, 6H), 2.41–2.48 (m, 2H), 4.56 (br s, 2H), 4.63 (t, 1H), 6.20 (s, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.

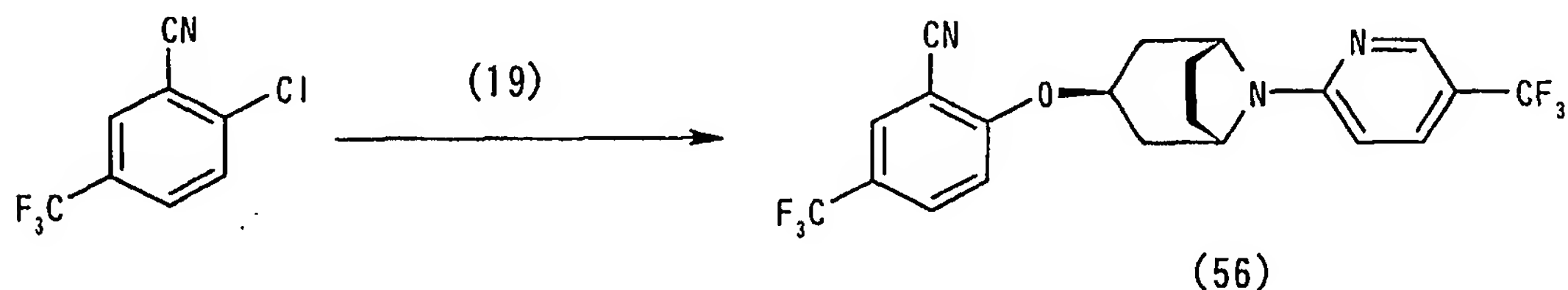
1.7-7.22 (m, 2H), 7.61 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

製造例 28

5-トリフルオロメチル-2-{3 α -[5-(トリフルオロメチル)ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクター-3-イオキシ}安息香酸 フラン-2-イル エステル (化合物番号 2-244) の製造

工程 1

3 α -[2-シアノ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (56) の製造



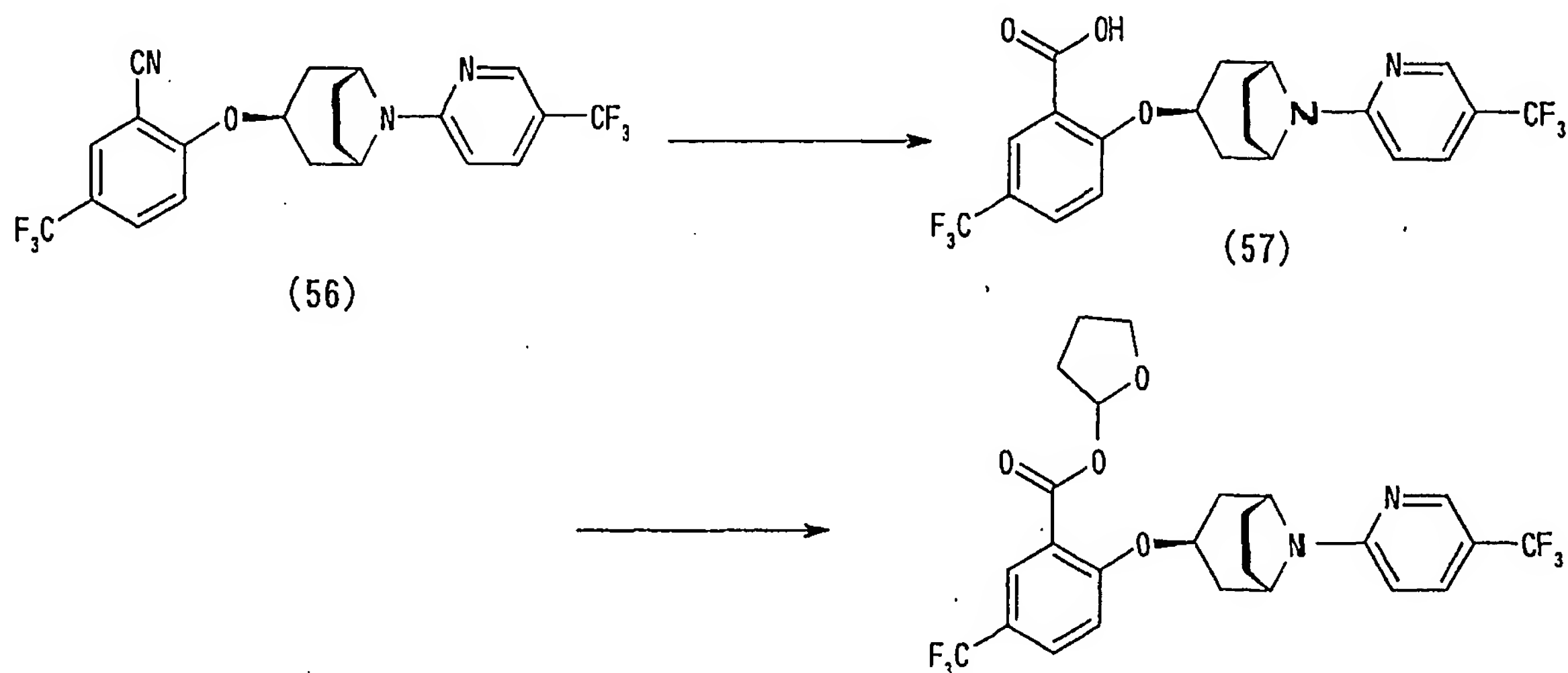
化合物 (19) (3.69 g) の DMF (30 ml) 溶液に、氷冷下、60% 水素化ナトリウム (0.71 g) を加えた。混合物を室温下 30 分間攪拌した後、4-クロロ-3-シアノベンゾトリフルオライド (2.78 g) を加えた。混合物を室温で 30 分間攪拌し、さらに 100℃ に昇温して 4 時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (56) (4.24 g) を得た。

mp. 110-113℃

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.01-2.45 (m, 8H), 4.60 (br s, 2H), 4.74 (t, 1H), 6.59 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

工程 2

5-トリフルオロメチル-2-{3 α -[5-(トリフルオロメチル)ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクター-3-イオキシ}安息香酸 フラン-2-イル エステルの製造



化合物(56)(4.24g)のエタノール(100ml)溶液に水酸化カリウム(5.38g)を加え、還流下一晩攪拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注ぎ、塩酸を用いて中和した後、酢酸エステルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。得られた結晶を酢酸(2.2ml)に溶解し、その溶液に氷冷下、亜硝酸ナトリウム(0.99g)と濃硫酸(3.59g)を少量ずつ加えた。混合物を室温まで昇温し5時間攪拌した。混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮して、粗製の化合物(57)(4.17g)を得た。

THF(2ml)に30℃以下の温度で塩化スルフリル(0.17g)を滴下し、室温で10分間攪拌することにより得られた溶液を、氷冷下、化合物(57)(0.20g)のTHF(4ml)溶液に滴下し、さらに、トリエチルアミン(0.22g)を加えた。この混合物を室温まで昇温し、30分間攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(72mg)を得た。

mp. 85-88℃

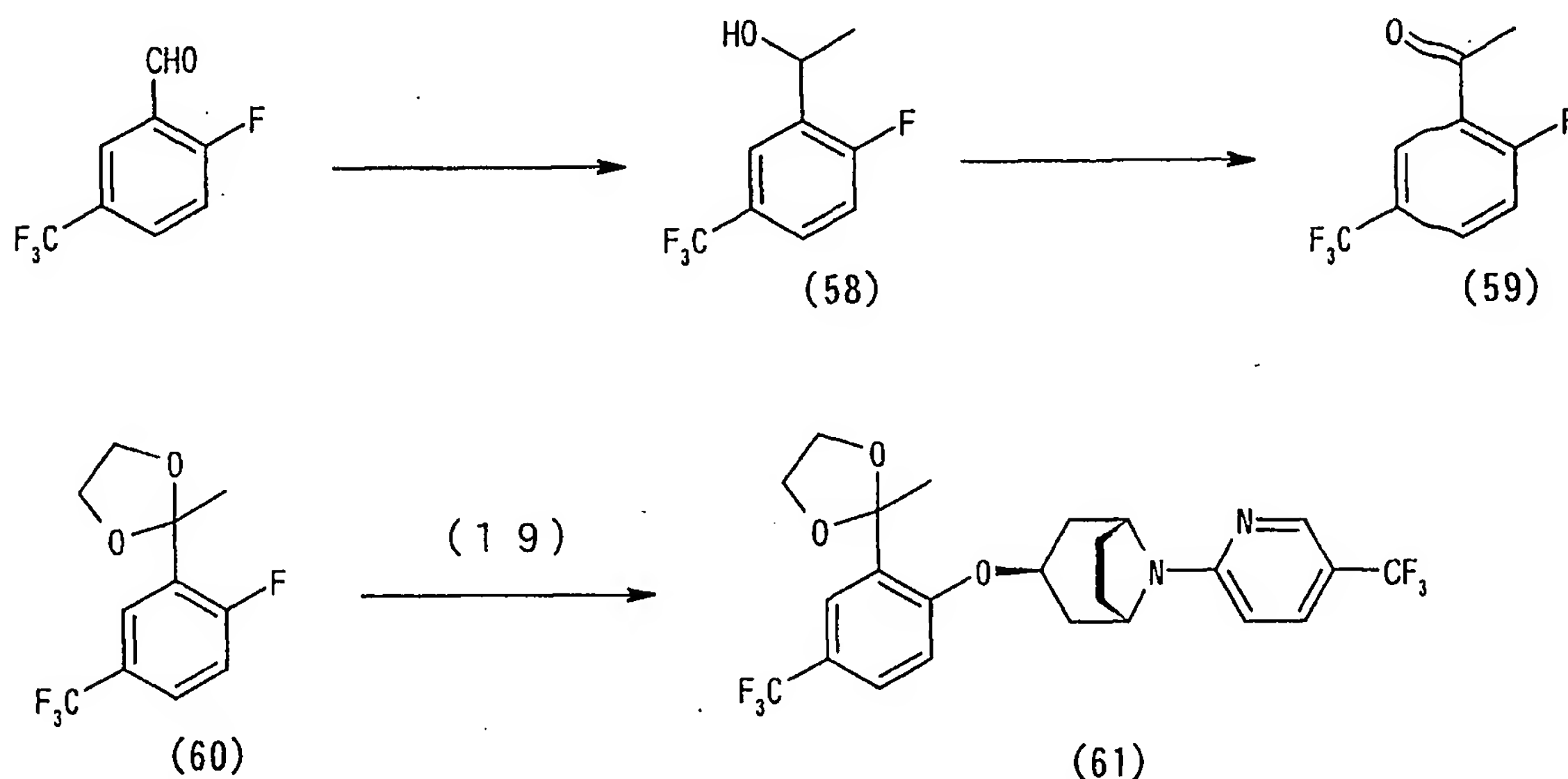
^1H NMR (CDCl₃) δ 2.01-2.23 (m, 10H), 2.35-2.47 (m, 2H), 4.56 (br s, 2H), 4.66 (t, 1H), 6.54-6.59 (m, 2H), 6.84 (d, 1H), 7.60-7.68 (m, 2H), 7.96 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

製造例 29

3 α -[2-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(化合物番号2-214)の製造

工程 1

3 α -[2-(2-メチル-[1,3]ジオキラン-2-イル)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(61)の製造



2-フルオロ-5-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(3.0g)のTHF(30ml)溶液に、窒素雰囲気下0℃で3.0Mメチルマグネシウムブロミド(7.8ml)を滴下した。混合物を室温まで昇温し、30分間攪拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮して、粗製の化合物(58)(3.42g)を得た。

粗製の化合物(58)(3.42g)のクロロホルム溶液に二酸化マンガン(6.78g)を加え、この懸濁液を加熱還流下2時間攪拌した。懸濁液を室温まで冷却した後に、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧濃縮して、粗製の化合物(U)を得た。

粗製の化合物(59)(1.00g)のベンゼン(10ml)溶液にエチレンジリコール(0.66g)とp-トルエンスルホン酸一水和物(0.09g)を加

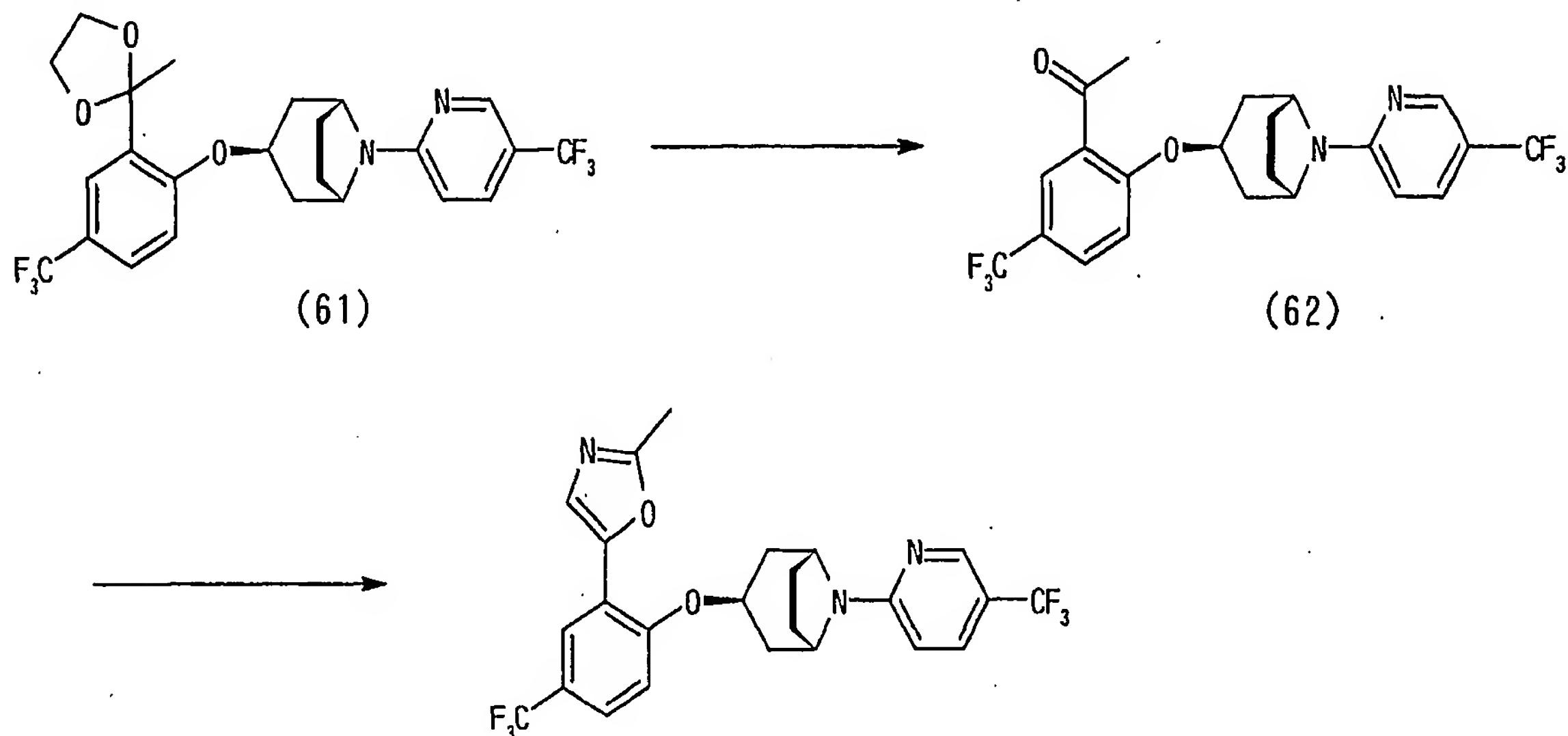
え、加熱還流下5時間撹拌した。混合物を室温まで冷却した後に、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮して、粗製の化合物(60)(1.13g)を得た。

化合物(19)(1.02g)のDMF(10ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.18g)を加えた。混合物を室温下30分間撹拌した後、粗製の化合物(60)(1.13g)を加えた。混合物を室温で30分間撹拌し、さらに100℃に昇温して8時間撹拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(61)(0.55g)を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.81 (s, 3H), 2.01–2.12 (m, 4H), 2.25–2.33 (m, 2H), 2.46–2.53 (m, 2H), 3.77–3.88 (m, 2H), 4.01–4.13 (m, 2H), 4.57–4.58 (m, 3H), 6.57 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.42 (s, 1H)

工程2

3 α -[2-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタンの製造



化合物(61)(0.55g)のTHF(21ml)溶液に6規定塩酸(21m

1) を加え、室温で2時間攪拌した。混合液を水に注ぎ、10%水酸化ナトリウム水溶液で中和した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮して、粗製の化合物(62)(0.46g)を得た。

粗製の化合物(62)(0.30g)を用いて、J. Heterocyclic Chem., 1998, 35, 1533-1534. に記載された方法で標記化合物(0.20g)を得た。

mp. 121-123°C

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.04-2.28 (m, 6H), 2.34-2.42 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 4.59 (br s, 2H), 4.71 (t, 1H), 6.58 (d, 1H) 6.83 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.42 (s, 1H)

上記実施例を含め本発明化合物の具体例を第1表～第14表に記載する。本発明の権利範囲はこれら実施例および具体例に限定されるものではない。

表中の略記号は以下の意味を示す。

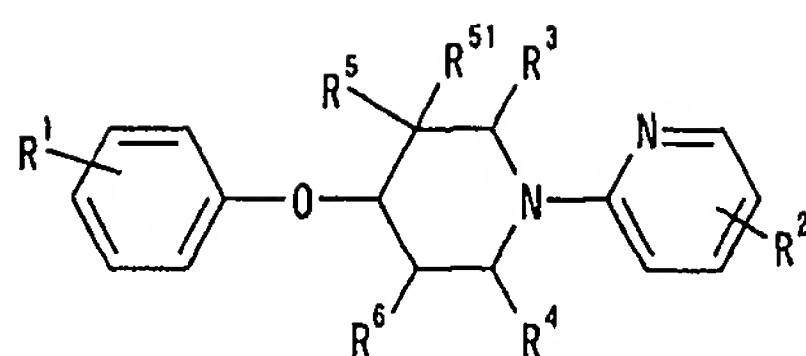
v i s ; 粘稠物

a m o r ; アモルファス

M e ; メチル、E t ; エチル、P r ; プロピル、B u ; ブチル、H e x ; ヘキシル、P e n ; ペンチル、i ; イソ、n ; ノルマル、t ; ターシャリー、c ; シクロ

A c : アセチル

表1



化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵¹	R ⁶	物理定数 [] : 融点 °C	備考
1-1	4-OH	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD22.2-1.5499	
1-2	3-OH	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-3	2-OH	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-5	4-F	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-6	3-F	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-7	2-F	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[72-74]	
1-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.1-1.5071	
1-10	4-Cl	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[90-92]	
1-11	3-Cl	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-12	2-Cl	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD21.8-1.5210	
1-14	3-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-15	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD21.9-1.5275	
1-16	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[65-66]	
1-17	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[71-73]	
1-18	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[70-72]	
1-19	4-Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[87-90]	
1-20	3-Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-21	2-Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-22	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD21.8-1.5320	
1-23	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD21.9-1.5365	
1-24	4-I	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-25	3-I	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-26	2-I	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-27	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-28	2-CF ₃ -4-I	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-29	4-CN	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[157-161]	
1-30	3-CN	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-31	2-CN	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-32	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[101-102]	
1-33	2-CF ₃ -4-CN	5-CF ₃	H	H	H	H	H		

表1(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵¹	R ⁶	物理定数 [] : 融点 °C	備考
1-34	4-N02	5-CF3	H	H	H	H	H	[140-144]	
1-35	3-N02	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-36	2-N02	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-37	2-Cl-4-CF3-6-N02	5-CF3	H	H	H	H	H	[69-70]	
1-38	2-N02-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[96-97]	
1-39	3-CF3-4-N02	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-40	2-CHO-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	[85-90]	
1-41	4-Me	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-42	3-Me	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-43	2-Me	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-44	2, 4-Me2	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.3-1.5410	
1-45	2-Me-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-46	2-Me-4-OCF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD24.4-1.5089	
1-47	2, 4, 6-Me3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.2-1.5339	
1-48	2-Me-4-F	5-CF3	H	H	H	H	H	nD24.3-1.5373	
1-49	2-Me-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.9-1.5505	
1-50	2-Me-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-51	2-Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-52	2-Me-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-53	2-Me-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-54	2-Et-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	nD24.6-1.5445	
1-55	2-Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-56	2-Et-4-OCF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-57	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H	nD24.9-1.5394	
1-58	2- ⁿ Pr-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-59	2- ⁿ Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.5-1.5141	
1-60	2- ⁱ Pr-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-61	2- ⁱ Pr-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-62	2- ⁱ Pr-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-63	2-CH2OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD26.2-1.5110	
1-64	2-CH2OMe-4-Cl	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-65	2-CH2OMe-4-Br	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-66	2-CH2OEt-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD23.3-1.5090	
1-67	2-CH(OH)Et-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-68	2-CH2OH-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-69	2-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	vis	
1-70	3-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H		
1-71	2-CH2OCH2OEt-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.5-1.5069	
1-72	2-CH2OCH(Me)OMe-4-CF3	5-CF3	H	H	H	H	H	nD22.6-1.5018	

表1(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵¹	R ⁶	物理定数 [] : 融点 °C	備考
1-73	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[68-71]	
1-74	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-75	4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[48-50]	
1-76	3-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.1-1.5151	
1-77	2-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-78	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-79	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD21.6-1.4889	
1-80	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-81	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-82	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-83	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.0-1.5150	
1-84	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.2-1.5089	
1-85	4-OMe	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[86-88]	
1-86	3-OMe	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-87	2-OMe	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-88	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD22.8-1.5150	
1-89	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[50-53]	
1-90	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl	H	H	H	H	H	vis	
1-91	2-OEt-4-CF ₃	5-Br	H	H	H	H	H	[39-41]	
1-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[55-65]	
1-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	Me	H	H	H	H	vis	
1-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me	H	H	H	H	H	nD21.4-1.5295	
1-95	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	Me	CO ₂ Et	H	vis	
1-96	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD22.2-1.4834	N-oxide(注1)
1-97	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	nD22.8-1.5000	cis
1-98	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	vis	trans
1-99	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD22.4-1.5088	
1-100	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD25.3-1.5060	
1-101	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[70-74]	
1-102	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[103-104]	
1-103	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[68-73]	
1-104	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-105	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.9-1.4969	
1-106	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-107	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[49-51]	
1-109	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me	H	H	H	H	H		
1-110	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-111	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-112	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN	H	H	H	H	H		
1-113	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-114	2-OCH ₂ ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	

注1)

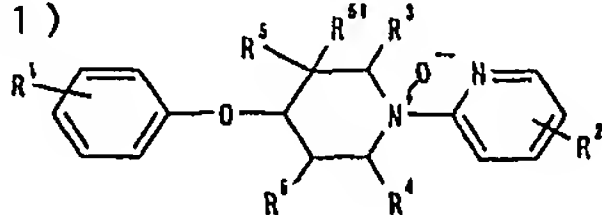


表 1 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵¹	R ⁶	物理定数 [] : 融点 °C	備考
1-115	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[51-54]	
1-116	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	H	H	H	H	H		
1-117	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-118	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD _{22.2} -1.5121	
1-119	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-120	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-121	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-122	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-123	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-124	2-OCH ₂ C(Me ₂)CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-125	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-126	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-127	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-128	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-129	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-130	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-131	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-132	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-133	4-OCF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[30-32]	
1-134	3-OCF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-135	2-OCF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-136	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-137	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-138	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-139	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[82-84]	
1-140	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-141	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-142	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[75-77]	
1-143	2-Oallynyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	

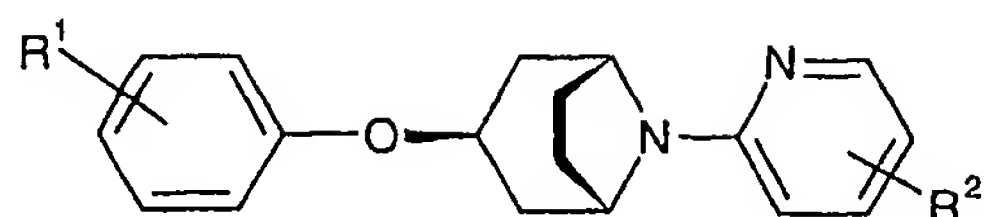
表1(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵¹	R ⁶	物理定数 [] : 融点 °C	備考
1-144	4-CO ₂ Me	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[124-126]	
1-145	3-CO ₂ Me	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-146	2-CO ₂ Me	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-147	4-SCF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[81-82]	
1-148	3-SCF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-149	2-SCF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-150	4-S(O)CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[83-86]	
1-151	3-S(O)CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-152	2-S(O)CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-153	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[52-54]	
1-154	3-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-155	2-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-156	4-OC(O)Ph	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[154-156]	
1-157	3-OC(O)Ph	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-158	2-OC(O)Ph	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-159	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[109-110]	
1-160	3-OCH ₂ Ph	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-161	2-OCH ₂ Ph	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-162	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[123-124]	
1-163	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-164	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[93-95]	
1-165	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃	H	H	H	H	H	[58-60]	
1-166	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-167	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[85-95]	
1-168	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD _{21.6} -1.5259	
1-169	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-170	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-171	2-NHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H		
1-172	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-173	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-174	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD _{22.0} -1.5121	
1-175	2-N(Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[110-114]	

表1(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵¹	R ⁶	物理定数 [] : 融点 °C	備考
1-176	2-OC(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.9-1.5000	
1-177	2-OC(O)SMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[77-79]	
1-178	3-CF ₃ -4-N(SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃	H	H	H	H	H	amor	
1-179	2-C(O)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-180	2-CH ₂ O- tetrahydrofuran- 2-yl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD22.7-1.5105	
1-181	2-(1,3- dioxolanyl)-4- CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.2-1.5155	
1-182	2-CH ₂ OnPr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	[67-70]	
1-183	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4- CF ₃	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	nD22.2-1.5062	cis:trans= 1:1
1-184	2-CH(Me)OCH ₂ OMe- 4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	nD23.7-1.4995	
1-185	2-CH ₂ OCH(Me)Et- 4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	Nd24.1-1.5015	
1-186	2-OnPr-4CF ₃	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	vis	cis
1-187	2-OnPr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	Et	H	H	vis	trans
1-188	2-CH ₂ OCH(Me)OMe- 4CF ₃	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	nD23.2-1.5035	trans
1-189	2-CH ₂ OCH(Me)OMe- 4CF ₃	5-CF ₃	H	H	Me	H	H	nD24.6-1.5039	cis
1-190	2-(3-Me-1,2,4- oxadiazol-5-yl)- 4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	H	H	H	vis	
1-191	2-OnPr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nPr	H	H	nD22.3-1.5055	cis
1-192	2-OnPr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nPr	H	H	vis	trans

表2

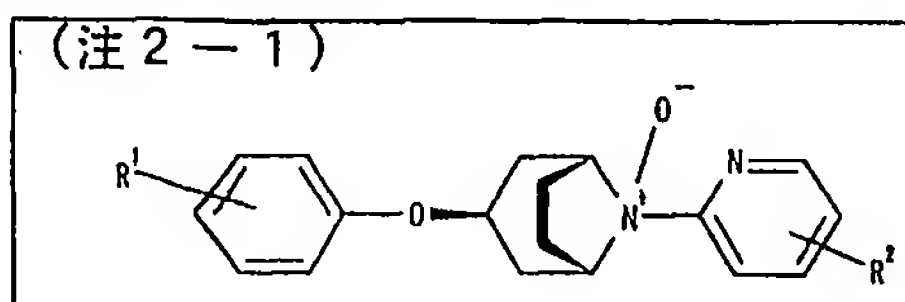


化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-1	4-OH	5-CF ₃		
2-2	3-OH	5-CF ₃		
2-3	2-OH	5-CF ₃		
2-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	[90-94]	
2-5	4-F	5-CF ₃		
2-6	3-F	5-CF ₃		
2-7	2-F	5-CF ₃		
2-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
2-10	4-Cl	5-CF ₃		
2-11	3-Cl	5-CF ₃		
2-12	2-Cl	5-CF ₃		
2-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
2-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
2-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
2-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-18	4-Br	5-CF ₃		
2-19	3-Br	5-CF ₃		
2-20	2-Br	5-CF ₃		
2-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	[112-115]	
2-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
2-23	4-I	5-CF ₃		
2-24	3-I	5-CF ₃		
2-25	2-I	5-CF ₃		
2-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-27	4-CN	5-CF ₃		
2-28	3-CN	5-CF ₃		
2-29	2-CN	5-CF ₃		
2-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	[110-113]	
2-31	4-NO ₂	5-CF ₃		
2-32	3-NO ₂	5-CF ₃		
2-33	2-NO ₂	5-CF ₃		
2-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		

(表2続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-35	2-N02-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-36	3-CF ₃ -4-N02	5-CF ₃		
2-37	2-CH0-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-38	4-Me	5-CF ₃		
2-39	3-Me	5-CF ₃		
2-40	2-Me	5-CF ₃		
2-41	2, 4-Me ₂	5-CF ₃		
2-42	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃	[121-123]	
2-43	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-44	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃	[88-91]	
2-45	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-46	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃		
2-47	2-Me-4-F	5-CF ₃	[98-100]	
2-48	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
2-49	2-Et-4-Cl	5-CF ₃		
2-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
2-51	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-52	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-53	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-54	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	[91-93]	
2-55	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-56	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-57	2-CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-58	2-CH ₂ CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-59	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[89-91]	
2-60	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[95-98]	N-oxide(注2-1)
2-61	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-62	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-63	4-CF ₃	5-CF ₃		
2-64	3-CF ₃	5-CF ₃		
2-65	2-CF ₃	5-CF ₃		
2-66	3, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
2-67	3, 5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	vis	
2-68	2, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
2-69	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		

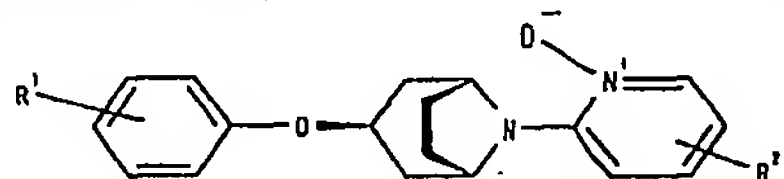
(注2-1)



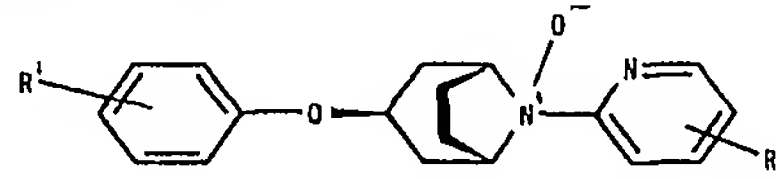
(表2 続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-70	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-71	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
2-72	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
2-73	4-OMe	5-CF ₃		
2-74	3-OMe	5-CF ₃		
2-75	2-OMe	5-CF ₃		
2-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃	[85-90]	
2-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
2-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
2-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃	vis	
2-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[90-92]	
2-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[143-145]	N-oxide (注2-2)
2-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[129-130]	N-oxide (注2-3)
2-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl	[92-97]	
2-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br	[50-52]	
2-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂	[159-160]	
2-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂	amor	
2-89	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me	[97-98]	
2-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me	amor	
2-91	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃		
2-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃	nD _{22.5} -1.5090	
2-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN	[124-125]	
2-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN	[132-134]	
2-95	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-96	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[113-115]	
2-97	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[53-55]	
2-98	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[126-129]	
2-99	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-100	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-101	2-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-102	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[69-73]	
2-103	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-104	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[114-116]	
2-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
2-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
2-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
2-109	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		

(注2-2)



(注2-3)



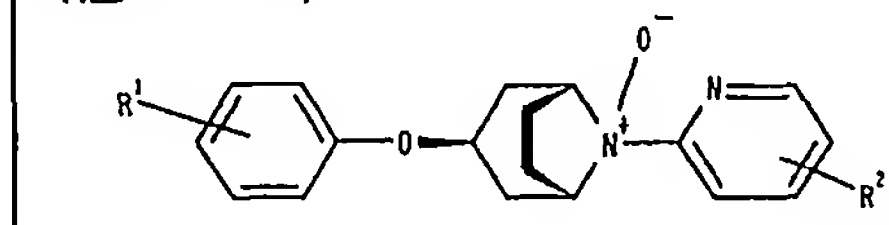
(表2続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-110	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		
2-111	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[148-150]	
2-112	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-113	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
2-114	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-115	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-116	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-117	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-118	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-119	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
2-120	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
2-121	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-122	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-123	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-124	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-125	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
2-126	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-127	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
2-128	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-129	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
2-130	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-131	4-OCF ₃	5-CF ₃		
2-132	3-OCF ₃	5-CF ₃		
2-133	2-OCF ₃	5-CF ₃		
2-134	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
2-135	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
2-136	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
2-137	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-138	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-139	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-140	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[115-118]	
2-141	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-142	2-Oallenyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
2-143	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-144	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-145	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[65-67]	cisとtransの混合物
2-146	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[54-57]	
2-147	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[96-98]	

(表2続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-148	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	cisとtransの混合物
2-149	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	[93-97]	
2-150	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[112-115]	
2-151	2-OS ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[107-110]	
2-152	2-OS ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[121-124]	
2-153	2-S ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	amor	
2-154	2-OS ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[133-136]	
2-155	2-OS ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[140-143]	
2-156	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[150-153]	
2-157	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[165-168]	
2-158	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[87-89]	
2-159	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	amor	
2-160	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[94-96]	
2-161	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-162	2-NHS ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[165-168]	
2-163	2-NHS ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[171-174]	
2-164	2-N(S ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[181-183]	
2-165	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[87-90]	
2-166	2-SCH ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[110-112]	
2-167	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
2-168	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	1,3-Me ₂ - pyrazolyl- 5-yl	[132-134]	
2-169	2-(1,3-dioxolanyl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[148-151]	
2-170	2-CH(Me)OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	nD _{23.7} -1.5045	
2-171	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	nD _{23.7} -1.5137	
2-172	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{24.1} -1.5263	
2-173	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	amor	
2-174	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[105-108]	N-oxide(注2-4)
2-175	2-OCH ₂ CH(OEt)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{22.8} -1.5138	
2-176	2-OCH ₂ CH(OS ₂ Me)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{22.9} -1.5092	
2-177	2-OCH(Me)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[89-91]	
2-178	2-OCH(Me)CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[56-58]	
2-179	2-(O-tetrahydrofuran-3-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[91-93]	

(注2-4)



(表2続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-180	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	[115-118]	
2-181	2-OCH ₂ CH(F)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[99-102]	
2-182	2-OCH ₂ SMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[76-80]	
2-183	2-OCH ₂ C(=CH ₂)Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	[83-85]	
2-184	2-CH(OH)nPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[141-145]	
2-185	2-CH(OMe)nPr-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd24.9-1.5070	
2-186	2-CH=CHEt-4-CF ₃	5-CF ₃	[94-98]	cis, trans混合物
2-187	2-nBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[86-88]	
2-188	2-CH=CHCO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[107-110]	cis, trans混合物
2-189	2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	amor	
2-190	2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.5-1.5249	
2-191	2-CH ₂ CH ₂ CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.6-1.5335	
2-192	2-CH ₂ CH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.6-1.5110	
2-193	2-CO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[94-98]	
2-194	2-CH(OH)sBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[121-124]	
2-195	2-OCH ₂ CH(Br)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[114-119]	
2-196	2-CO ₂ iPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[95-97]	
2-197	2-CH(OH)CH ₂ tBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[179-181]	
2-198	2-CO ₂ tBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[118-120]	
2-199	2-(4-Me-oxazoliziny-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[102-106]	
2-200	2-(3-Me-1,2,4-oxadiazoyl-5-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[148-151]	
2-201	2-(5-Me-oxazoliziny-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[105-107]	
2-202	2-(5-Me-1,3,4-oxadiazolyl-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[177-179]	
2-203	2-CH=NOEt-4-CF ₃	5-CF ₃	amor	(E)
2-204	2-CO ₂ CH ₂ C≡CH-4-CF ₃	5-CF ₃	[95-97]	
2-205	2-(5-Me-oxazolyl-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[120-122]	
2-206	2-CO ₂ CH(Me)C≡CH-4-CF ₃	5-CF ₃	[111-113]	
2-207	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	[24-25]	
2-208	2-CO ₂ sBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[92-94]	
2-209	2-(4-Me-oxazolyl-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[100-103]	
2-210	2-(4,4-Me ₂ -oxazoliziny-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[122-124]	
2-211	2-CH=NOMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[92-94]	

(表2続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-212	2-ON=C(Me)2-4-CF ₃	5-CF ₃	[107-109]	
2-213	2-ON=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[64-66]	E, Z 混合物
2-214	2-(2-Me-oxazolyl-5-yl)- 4-CF ₃	5-CF ₃	[121-123]	
2-215	2-CH=NOiPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[110-112]	
2-216	2-(5-Me-1,2,4- oxadiazolyl-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[174-177]	
2-217	2-(5-OMe-oxazolyl-2- yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[143-146]	
2-218	2-C(Me)=NOEt-4-CF ₃	5-CF ₃	[91-94]	(E)
2-219	2-C(Me)=NOEt-4-CF ₃	5-CF ₃	[92-96]	(Z)
2-220	2-(4-Et-oxazoliziny-2- yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[95-99]	
2-221	2-CH=NOCH ₂ C≡CH-4-CF ₃	5-CF ₃	[96-98]	
2-222	2-N=C(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[81-83]	(E)
2-223	2-CO ₂ cPen-4-CF ₃	5-CF ₃	[66-68]	
2-224	2-N=C(Me)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	(E)
2-225	2-CO ₂ - (tetrahydrofuranyl-3- yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[94-96]	
2-226	2-ON=C(Me)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[77-80]	E, Z 混合物
2-227	2- ON=(cyclopentylidenyl)- 4-CF ₃	5-CF ₃	[96-98]	
2-228	2-ON=CHEt-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.2-1.5170	E, Z 混合物
2-229	2- ON=(cyclohexylidenyl)- 4-CF ₃	5-CF ₃	[99-103]	
2-230	2-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.5-1.5159	
2-231	2-CO ₂ cHex-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.4-1.5042	
2-232	2-CO ₂ CH(Me)iPr-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.4-1.5083	
2-233	2-CO ₂ CH(Me)CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.4-1.5105	
2-234	2-CO ₂ CH(Me)CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.8-1.5065	
2-235	2-CO ₂ CH(Me)CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[77-81]	
2-236	2-CO ₂ CH(Me)CH ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃	[94-98]	
2-237	2-CO ₂ CH ₂ cPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[90-94]	
2-238	2-CO ₂ cPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[143-145]	
2-239	2-CO ₂ CH(Me)cPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[123-125]	
2-240	2-CO ₂ CH ₂ CF ₃ -4-CF ₃	5-CF ₃	[83-86]	

(表2続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
2-241	2-OC(O)OiPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[38-42]	
2-242	2-CH ₂ ON=C(Me)2-4-CF ₃	5-CF ₃	[110-112]	
2-243	2-NHC(O)2iPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[140-143]	
2-244	2-CO ₂ -(tetrahydrofuran-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[85-88]	
2-245	2-OC(=C(Me)2)-4-CF ₃	5-CF ₃	[90-92]	
2-246	2-OCH ₂ CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[85-87]	
2-247	2-CO ₂ CH(Me)CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[119-121]	N-oxide (注2-5)
2-248	2-ON=C(Me)CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[105-108]	(Z)
2-249	2-ON=C(Me)CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[58-62]	(E)
2-250	2-ON=C(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[120-122]	(E)

(注2-5)

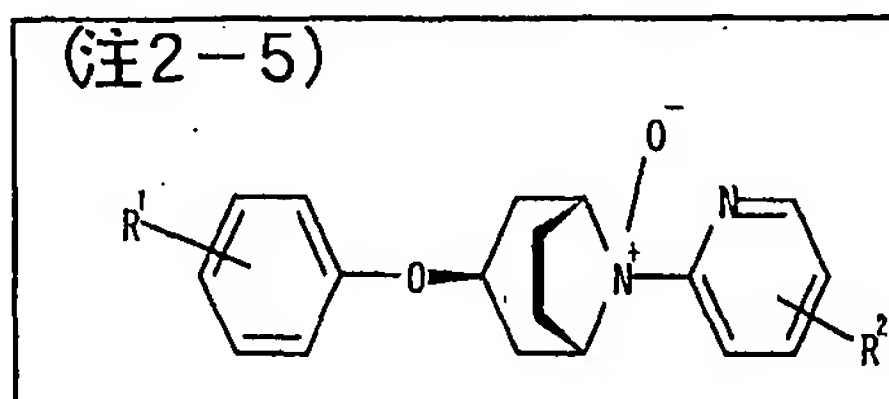
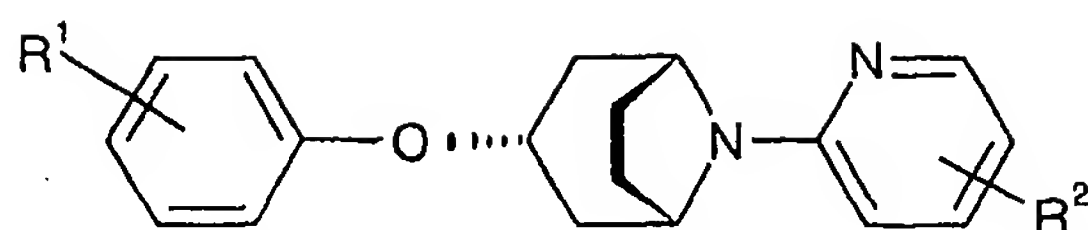


表3



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
3-1	4-OH	5-CF ₃		
3-2	3-OH	5-CF ₃		
3-3	2-OH	5-CF ₃		
3-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-5	4-F	5-CF ₃		
3-6	3-F	5-CF ₃		
3-7	2-F	5-CF ₃		
3-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
3-10	4-Cl	5-CF ₃		
3-11	3-Cl	5-CF ₃		
3-12	2-Cl	5-CF ₃		
3-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
3-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
3-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-18	4-Br	5-CF ₃		
3-19	3-Br	5-CF ₃		
3-20	2-Br	5-CF ₃		
3-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
3-23	4-I	5-CF ₃		
3-24	3-I	5-CF ₃		
3-25	2-I	5-CF ₃		
3-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-27	4-CN	5-CF ₃		
3-28	3-CN	5-CF ₃		
3-29	2-CN	5-CF ₃		
3-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-31	4-NO ₂	5-CF ₃		
3-32	3-NO ₂	5-CF ₃		
3-33	2-NO ₂	5-CF ₃		
3-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		
3-35	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		

表3(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
3-36	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃		
3-37	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-38	4-Me	5-CF ₃		
3-39	3-Me	5-CF ₃		
3-40	2-Me	5-CF ₃		
3-41	2, 4-Me ₂	5-CF ₃		
3-42	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃		
3-43	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-44	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃		
3-45	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-46	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃		
3-47	2-Me-4-F	5-CF ₃		
3-48	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
3-49	2-Et-4-Cl	5-CF ₃		
3-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
3-51	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-52	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-53	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-54	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-55	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-56	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-57	2-CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-58	2-CH ₂ CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-59	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-60	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-61	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-62	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
3-63	4-CF ₃	5-CF ₃	[56-58]	
3-64	3-CF ₃	5-CF ₃		
3-65	2-CF ₃	5-CF ₃		
3-66	3, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
3-67	3, 5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
3-68	2, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
3-69	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-70	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-71	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
3-72	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		

表3(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
3-73	4-OMe	5-CF ₃		
3-74	3-OMe	5-CF ₃		
3-75	2-OMe	5-CF ₃		
3-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃		
3-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
3-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
3-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃		
3-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[56-58]	
3-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl		
3-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br		
3-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂		
3-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂		
3-89	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me		
3-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH-SO ₂ Me		
3-91	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃		
3-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃		
3-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN		
3-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN		
3-95	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-96	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-97	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-98	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-99	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-100	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-101	2-CH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-102	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-103	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-104	2-CH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-105	2-CH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-106	2-CH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
3-107	2-CH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
3-108	2-CH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
3-109	2-CH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		
3-110	2-CH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		
3-111	2-CH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		

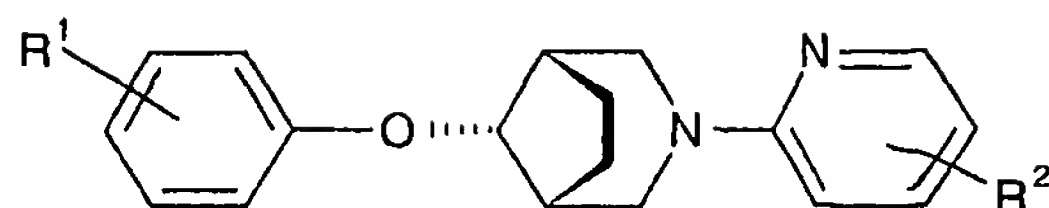
表3(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
3-112	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-113	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
3-114	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-115	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-116	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-117	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-118	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-119	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-120	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-121	2-OCH ₂ C(Me ₂)CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-122	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-123	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-124	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-125	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-126	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-127	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-128	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-129	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-130	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-131	4-OCF ₃	5-CF ₃	92-93	
3-132	3-OCF ₃	5-CF ₃		
3-133	2-OCF ₃	5-CF ₃		
3-134	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
3-135	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
3-136	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
3-137	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-138	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-139	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-140	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-141	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-142	2-Oallynyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-143	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-144	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-145	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-146	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-147	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-148	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-149	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-150	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		

表3(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
3-151	2-OS02Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-152	2-OS02Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-153	2-S02 ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-154	2-OS02 ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-155	2-OS02NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-156	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-157	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-158	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-159	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-160	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-161	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-162	2-NHS02Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-163	2-NHS02Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-164	2-N(S02 ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
3-165	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-166	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
3-167	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		

表4



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
4-1	4-OH	5-CF ₃		
4-2	3-OH	5-CF ₃		
4-3	2-OH	5-CF ₃		
4-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-5	4-F	5-CF ₃		
4-6	3-F	5-CF ₃		
4-7	2-F	5-CF ₃		
4-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
4-10	4-Cl	5-CF ₃		
4-11	3-Cl	5-CF ₃		
4-12	2-Cl	5-CF ₃		
4-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
4-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
4-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-18	4-Br	5-CF ₃		
4-19	3-Br	5-CF ₃		
4-20	2-Br	5-CF ₃		
4-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
4-23	4-I	5-CF ₃		
4-24	3-I	5-CF ₃		
4-25	2-I	5-CF ₃		
4-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-27	4-CN	5-CF ₃		
4-28	3-CN	5-CF ₃		
4-29	2-CN	5-CF ₃		
4-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-31	4-NO ₂	5-CF ₃		
4-32	3-NO ₂	5-CF ₃		
4-33	2-NO ₂	5-CF ₃		
4-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		

表4(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
4-35	2-N02-4-CF3	5-CF3		
4-36	3-CF3-4-N02	5-CF3		
4-37	2-CHO-4-CF3	5-CF3		
4-38	4-Me	5-CF3		
4-39	3-Me	5-CF3		
4-40	2-Me	5-CF3		
4-41	2, 4-Me2	5-CF3		
4-42	2-Me-3-CF3	5-CF3		
4-43	2-Me-4-CF3	5-CF3		
4-44	2-Me-4-OCF3	5-CF3		
4-45	2-Et-4-CF3	5-CF3		
4-46	2, 4, 6-Me3	5-CF3		
4-47	2-Me-4-F	5-CF3		
4-48	2-Me-4-Cl	5-CF3		
4-49	2-Et-4-Cl	5-CF3		
4-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF3		
4-51	2- ⁿ Pr-4-CF3	5-CF3		
4-52	2- ⁱ Pr-4-CF3	5-CF3		
4-53	2-CH2OMe-4-CF3	5-CF3		
4-54	2-CH2OEt-4-CF3	5-CF3		
4-55	2-CH(OH)Et-4-CF3	5-CF3		
4-56	2-CH2OH-4-CF3	5-CF3		
4-57	2-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3		
4-58	2-CH2OCH2OEt-4-CF3	5-CF3		
4-59	2-CH2OCH(Me)OMe-4-CF3	5-CF3		
4-60	2-CH2OCH(Me)OMe-4-CF3	5-CF3		
4-61	2-CH=CHMe-4-CF3	5-CF3		
4-62	2-allyl-4-CF3	5-CF3		
4-63	4-CF3	5-CF3		
4-64	3-CF3	5-CF3		
4-65	2-CF3	5-CF3		
4-66	3, 4-(CF3)2	5-CF3		
4-67	3, 5-(CF3)2	5-CF3		
4-68	2, 4-(CF3)2	5-CF3		
4-69	2-CH2Cl-4-CF3	5-CF3		
4-70	2-CH(Cl)Et-4-CF3	5-CF3		
4-71	4-CF3	3-Cl-5-CF3		
4-72	4-CF3	4-Me-6-CF3		

表4(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 []: 融点 °C	備考
4-73	4-OMe	5-CF ₃		
4-74	3-OMe	5-CF ₃		
4-75	2-OMe	5-CF ₃		
4-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃		
4-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
4-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
4-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃		
4-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[55-57]	
4-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl		
4-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br		
4-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂		
4-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂		
4-89	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me		
4-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me		
4-91	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃		
4-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃		
4-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN		
4-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN		
4-95	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-96	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-97	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-98	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-99	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-100	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-101	2-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-102	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-103	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-104	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
4-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
4-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
4-109	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		
4-110	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		
4-111	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		

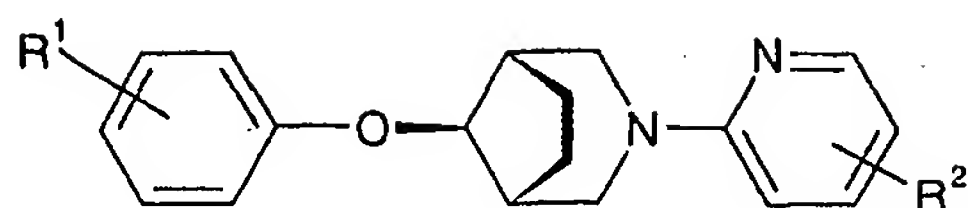
表4(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
4-112	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-113	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
4-114	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-115	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-116	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-117	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-118	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-119	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-120	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-121	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-122	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-123	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-124	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-125	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-126	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-127	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-128	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-129	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-130	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-131	4-OCF ₃	5-CF ₃		
4-132	3-OCF ₃	5-CF ₃		
4-133	2-OCF ₃	5-CF ₃		
4-134	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
4-135	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
4-136	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
4-137	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-138	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-139	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-140	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-141	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-142	2-Oallenyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-143	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-144	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-145	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-146	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-147	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-148	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-149	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		

表4(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
4-150	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-151	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-152	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-153	2-SO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-154	2-OSO ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-155	2-OSO ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-156	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-157	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-158	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-159	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-160	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-161	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-162	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-163	2-NHSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-164	2-N(SO ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
4-165	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-166	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
4-167	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		

表5



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-1	4-OH	5-CF ₃		
5-2	3-OH	5-CF ₃		
5-3	2-OH	5-CF ₃		
5-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	amor	
5-5	4-F	5-CF ₃		
5-6	3-F	5-CF ₃		
5-7	2-F	5-CF ₃		
5-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
5-10	4-Cl	5-CF ₃		
5-11	3-Cl	5-CF ₃		
5-12	2-Cl	5-CF ₃		
5-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-14	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-15	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
5-16	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
5-17	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
5-18	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-19	4-Br	5-CF ₃		
5-20	3-Br	5-CF ₃		
5-21	2-Br	5-CF ₃		
5-22	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	[85-87]	
5-23	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
5-24	4-I	5-CF ₃		
5-25	3-I	5-CF ₃		
5-26	2-I	5-CF ₃		
5-27	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-28	2-CF ₃ -4-I	5-CF ₃		
5-29	4-CN	5-CF ₃		
5-30	3-CN	5-CF ₃		
5-31	2-CN	5-CF ₃		
5-32	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	[125-126]	
5-33	2-CF ₃ -4-CN	5-CF ₃		
5-34	4-NO ₂	5-CF ₃		
5-35	3-NO ₂	5-CF ₃		

表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-36	2-N02	5-CF3		
5-37	2-Cl-4-CF3-6-N02	5-CF3		
5-38	2-N02-4-CF3	5-CF3	[107-109]	
5-39	3-CF3-4-N02	5-CF3		
5-40	2-CHO-4-CF3	5-CF3		
5-41	4-Me	5-CF3		
5-42	3-Me	5-CF3		
5-43	2-Me	5-CF3		
5-44	2, 4-Me2	5-CF3		
5-45	2-Me-4-CF3	5-CF3		
5-46	2-Me-4-OCF3	5-CF3		
5-47	2, 4, 6-Me3	5-CF3		
5-48	2-Me-4-F	5-CF3		
5-49	2-Me-4-Cl	5-CF3		
5-50	2-Me-4-Br	5-CF3		
5-51	2-Et-4-CF3	5-CF3		
5-52	2-Me-4-Cl	5-CF3		
5-53	2-Me-4-Br	5-CF3		
5-54	2-Et-4-Cl	5-CF3		
5-55	2-Et-4-CF3	5-CF3		
5-56	2-Et-4-OCF3	5-CF3		
5-57	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF3		
5-58	2- ⁿ Pr-4-Br	5-CF3		
5-59	2- ⁿ Pr-4-CF3	5-CF3		
5-60	2- ⁱ Pr-4-CF3	5-CF3		
5-61	2- ⁱ Pr-4-Cl	5-CF3		
5-62	2- ⁱ Pr-4-Br	5-CF3		
5-63	2-CH2OMe-4-CF3	5-CF3		
5-64	2-CH2OMe-4-Cl	5-CF3		
5-65	2-CH2OMe-4-Br	5-CF3		
5-66	2-CH2OEt-4-CF3	5-CF3		
5-67	2-CH(OH)Et-4-CF3	5-CF3		
5-68	2-CH2OH-4-CF3	5-CF3		
5-69	2-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	vis	
5-70	3-CH2OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	nD22.5-1.5110	
5-71	2-CH2OCH2OEt-4-CF3	5-CF3		
5-72	2-CH2OCH(Me)OMe-4-CF3	5-CF3	[56-57]	
5-73	2-CH(Me)OCH2OMe-4-CF3	5-CF3	vis	

表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-74	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-75	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	amor	
5-76	4-CF ₃	5-CF ₃		
5-77	3-CF ₃	5-CF ₃		
5-78	2-CF ₃	5-CF ₃		
5-79	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
5-80	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
5-81	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
5-82	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-83	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-84	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
5-85	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
5-86	4-OMe	5-CF ₃		
5-87	3-OMe	5-CF ₃		
5-88	2-OMe	5-CF ₃		
5-89	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-90	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-91	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
5-92	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
5-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CH ₂ F	vis	
5-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me		
5-95	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	4-CF ₃		
5-96	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN	[95-97]	
5-97	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[48-50]	
5-98	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	N-oxide(注4)
5-99	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CHF ₂	vis	
5-100	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CHO	[98-100]	
5-101	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CH ₂ OH	vis	
5-102	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃	[97-101]	
5-103	3-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-104	2-(O ^t Pr-2,2-Cl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-105	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[74-77]	
5-106	2-OBn-4-CF ₃	5-CF ₃	nD ₂₂ 1.5441	
5-107	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-108	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-109	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		

注4)

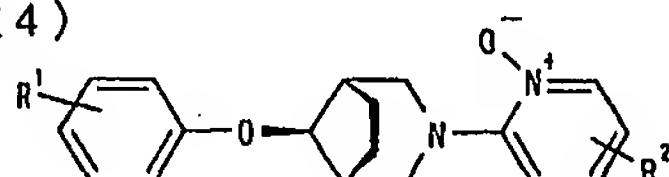


表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-110	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[86-88]	
5-111	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	[117-119]	
5-112	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-113	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-114	2-OCH ₂ CH(Me)OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-115	2-OCH ₂ C(Me) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-116	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[51-53]	
5-117	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me	[136-138]	
5-118	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃	vis	
5-119	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃	[106-109]	
5-120	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN	[87-89]	
5-121	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃	[109-112]	
5-122	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-123	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-124	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-125	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	[90-92]	
5-126	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-127	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-128	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-129	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-130	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-131	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-132	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-133	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-134	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-135	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[61-62]	
5-136	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-137	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-138	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-139	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-140	4-OCF ₃	5-CF ₃		
5-141	3-OCF ₃	5-CF ₃		
5-142	2-OCF ₃	5-CF ₃		
5-143	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
5-144	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
5-145	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
5-146	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-147	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-148	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		

表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-149	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	[47-51]	
5-150	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-151	4-CO ₂ Me	5-CF ₃		
5-152	3-CO ₂ Me	5-CF ₃		
5-153	2-CO ₂ Me	5-CF ₃		
5-154	4-SCF ₃	5-CF ₃		
5-155	3-SCF ₃	5-CF ₃		
5-156	2-SCF ₃	5-CF ₃		
5-157	4-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
5-158	3-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
5-159	2-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
5-160	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
5-161	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[159-161]	
5-162	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[123-126]	
5-163	2-OSO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-164	2-OSO ₂ ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[109-112]	
5-165	3-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
5-166	2-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
5-167	4-OC(O)Ph	5-CF ₃		
5-168	3-OC(O)Ph	5-CF ₃		
5-169	2-OC(O)Ph	5-CF ₃		
5-170	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
5-171	3-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
5-172	2-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
5-173	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃		
5-174	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[70-74]	
5-175	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	cisとtransの 混合物
5-176	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-177	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-178	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-179	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃		
5-180	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃		
5-181	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	[157-159]	
5-182	2-OCH ₂ C(=NOH)Me-4-CF ₃ (anti)	5-CF ₃	[120-123]	(E)
5-183	2-OCH ₂ C(=NOH)Me-4-CF ₃ (syn)	5-CF ₃	[55-59]	(Z)
5-184	2-OCH ₂ C(=NOMe)Me-4-CF ₃ (anti)	5-CF ₃	nD _{23.6} -1.5100	(E)

表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-185	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃		
5-186	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[110-113]	
5-187	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
5-188	2-NHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-189	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-190	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[65-67]	
5-191	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[64-67]	
5-192	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
5-193	2-NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	[130-132]	
5-194	2-N(Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-195	2-OC(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-196	2-OC(O)SMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
5-197	3-CF ₃ -4-N(SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃		
5-198	2-OC(O)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[101-105]	
5-199	2-OC(O) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[104-106]	
5-200	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[127-130]	
5-201	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	[179-182]	
5-202	2-(O ⁿ Pr-2,2-Cl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₂ H		
5-203	2-(1,3-dioxolan-2-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-204	2-(tetrahydrofuran-2-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-205	2-(tetrahydrofuran-3-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	[53-55]	
5-206	2-(furan-2-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-207	2-(furan-3-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-208	2-(thiophen-3-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-209	2-(thiophen-2-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-210	2-(OcPr-2,2-Cl ₂)-4-CF ₃	5-Me		
5-211	2-(pyridin-3-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	nD22.3-1.5329	
5-212	2-(pyridin-2-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	nD22.3-1.5335	
5-213	2-(oxetan-2-ylmethoxy)-4-CF ₃	5-CF ₃	nD23.2-1.5227	
5-214	2-(tetrahydrofuran-2-yloxymethyl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[78-80]	

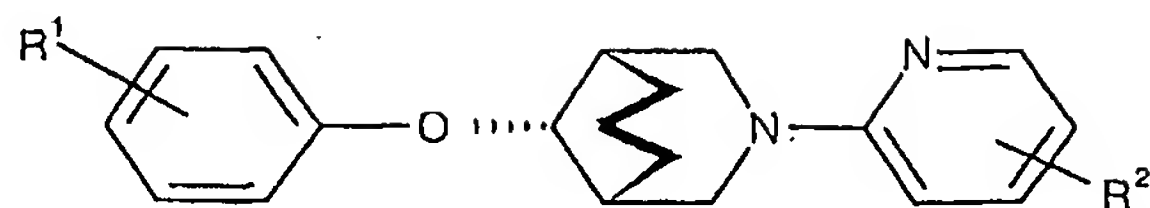
表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-215	2-(1,3-dioxolan-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[123-126]	
5-216	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	[145-148]	
5-217	2-CH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	nD _{22.2} -1.5158	
5-218	2-(4-Me-1,3-dioxolan-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[134-138]	
5-219	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	[138-141]	
5-220	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	[70-74]	
5-221	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	[113-116]	
5-222	2-CH ₂ OCH(OMe)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	nD _{25.0} -1.5087	
5-223	2-CH ₂ O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{24.5} -1.5123	
5-224	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{24.9} -1.5145	
5-225	2-CH ₂ O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[88-91]	
5-226	2-CH ₂ OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{24.9} -1.5265	
5-227	2-CH(OH) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{24.9} -1.5188	
5-228	2-CH(OMe) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{24.8} -1.5057	
5-229	2-CH ₂ OCH(Me)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-230	2-CH ₂ OCH(Me)CN-4-CF ₃	5-CF ₃	[105-109]	
5-231	2-(CH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[90-94]	
5-232	2-OCH ₂ C≡CMe-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{22.3} -1.5241	
5-233	2-CO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[89-91]	
5-234	2-OSO ₂ CF ₃ -4-CF ₃	5-CF ₃	[96-98]	
5-235	2-(2,3-dihydrofuran-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[109-111]	
5-236	2-(2,5-dihydrofuran-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[110-112]	
5-237	2-(tetrahydrofuran-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[124-126]	
5-238	2-CH(OH) ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[101-105]	
5-239	2-CH(OH) ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[50-53]	
5-240	2-C(O) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[122-125]	
5-241	2-(4,5-dihydrofuran-3-yl-4-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[126-128]	
5-242	2-CH ₂ OCH(Me)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{23.2} -1.5105	
5-243	2-CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd _{22.3} -1.5229	
5-244	2-CO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[70-75]	
5-245	2-CO ₂ ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[113-116]	
5-246	2-CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
5-247	2-CH=CHOMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	

表5(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
5-248	2-CO ₂ H-4-CF ₃	5-CF ₃	[151-155]	
5-249	2-C(O)N(Me)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[128-131]	
5-250	2-CONH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[179-183]	
5-251	2-C(O)NH ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	[195-198]	
5-252	2-(2-Me-1,3-dioxolan-2-yl)- 4-CF ₃	5-CF ₃	[162-164]	
5-253	2-C(O)N(Me)iPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[148-150]	
5-254	2-C(O)NH ₂ iPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[196-199]	
5-255	2-CH(OH)CH ₂ tBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[143-145]	
5-256	2-(3-Me-1,2,4-oxadiazol-5- yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[136-138]	
5-257	2-CO ₂ tBu-4-CF ₃	5-CF ₃	[159-162]	
5-258	2-CH(OAc)CH ₂ iPr-4-CF ₃	5-CF ₃	Nd22.7-1.4952	
5-259	2-(4-Me-oxazolizin-2-yl)-4- CF ₃	5-CF ₃	[122-126]	
5-260	2-(5-Me-oxazolizin-2-yl)-4- CF ₃	5-CF ₃	[97-99]	
5-261	2-(4-Me-oxazol-2-yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[126-129]	
5-262	2-(4,4-Me ₂ -oxazolizin-2- yl)-4-CF ₃	5-CF ₃	[141-143]	
5-263	2-(4-Et-oxazolizin-2-yl)-4- CF ₃	5-CF ₃	[105-109]	
5-264	4-CF ₃	5-CF ₃	[112-115]	
5-265	5-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃	[80-83]	

表 6



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
6-1	4-OH	5-CF ₃	
6-2	3-OH	5-CF ₃	
6-3	2-OH	5-CF ₃	
6-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	amor
6-5	4-F	5-CF ₃	
6-6	3-F	5-CF ₃	
6-7	2-F	5-CF ₃	
6-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃	
6-10	4-Cl	5-CF ₃	
6-11	3-Cl	5-CF ₃	
6-12	2-Cl	5-CF ₃	
6-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃	
6-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	
6-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-18	4-Br	5-CF ₃	
6-19	3-Br	5-CF ₃	
6-20	2-Br	5-CF ₃	
6-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃	
6-23	4-I	5-CF ₃	
6-24	3-I	5-CF ₃	
6-25	2-I	5-CF ₃	
6-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-27	4-CN	5-CF ₃	
6-28	3-CN	5-CF ₃	
6-29	2-CN	5-CF ₃	
6-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-31	4-NO ₂	5-CF ₃	
6-32	3-NO ₂	5-CF ₃	
6-33	2-NO ₂	5-CF ₃	

表 6 (続 き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
6-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃	
6-35	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-36	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃	
6-37	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-38	4-Me	5-CF ₃	
6-39	3-Me	5-CF ₃	
6-40	2-Me	5-CF ₃	
6-41	2, 4-Me ₂	5-CF ₃	
6-42	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃	
6-43	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-44	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃	
6-45	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-46	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃	
6-47	2-Me-4-F	5-CF ₃	
6-48	2-Me-4-Cl	5-CF ₃	
6-49	2-Et-4-Cl	5-CF ₃	
6-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃	
6-51	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-52	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-53	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-54	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-55	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-56	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-57	2-CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-58	2-CH ₂ CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-59	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-60	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-61	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-62	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-63	4-CF ₃	5-CF ₃	
6-64	3-CF ₃	5-CF ₃	
6-65	2-CF ₃	5-CF ₃	
6-66	3, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
6-67	3, 5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
6-68	2, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
6-69	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-70	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	

表 6 (続 き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
6-71	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	
6-72	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃	
6-73	4-OMe	5-CF ₃	
6-74	3-OMe	5-CF ₃	
6-75	2-OMe	5-CF ₃	
6-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃	
6-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl	
6-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br	
6-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃	
6-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
6-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl	
6-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br	
6-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂	
6-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂	
6-89	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me	
6-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me	
6-91	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃	
6-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃	
6-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN	
6-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN	
6-95	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-96	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-97	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-98	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-99	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-100	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-101	2-CH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-102	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	[70-74]
6-103	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-104	2-CH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-105	2-CH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-106	2-CH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me	
6-107	2-CH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃	
6-108	2-CH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃	
6-109	2-CH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN	
6-110	2-CH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃	
6-111	2-CH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	

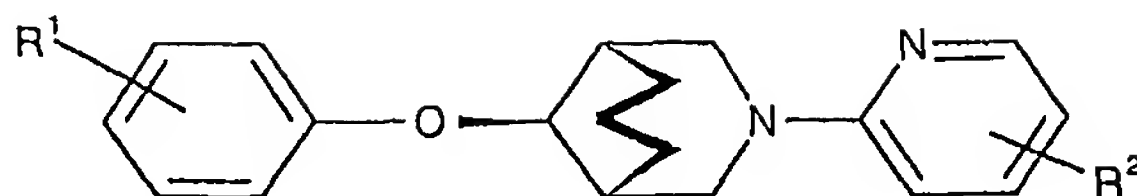
表 6 (続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
6-112	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-113	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	
6-114	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-115	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-116	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-117	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-118	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-119	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-120	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-121	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-122	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-123	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-124	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-125	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-126	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-127	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-128	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-129	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-130	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-131	4-OCF ₃	5-CF ₃	
6-132	3-OCF ₃	5-CF ₃	
6-133	2-OCF ₃	5-CF ₃	
6-134	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
6-135	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
6-136	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
6-137	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-138	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-139	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-140	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-141	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-142	2-Oallynyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-143	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-144	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-145	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-146	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-147	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-148	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃	

表6(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
6-149	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-150	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-151	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-152	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-153	2-SO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-154	2-OSO ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-155	2-OSO ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-156	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-157	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-158	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-159	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-160	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-161	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-162	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-163	2-NHSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-164	2-N(SO ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
6-165	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-166	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
6-167	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	

表 7



化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
7-1	4-OH	5-CF ₃	
7-2	3-OH	5-CF ₃	
7-3	2-OH	5-CF ₃	
7-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	[108-110]
7-5	4-F	5-CF ₃	
7-6	3-F	5-CF ₃	
7-7	2-F	5-CF ₃	
7-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃	
7-10	4-Cl	5-CF ₃	
7-11	3-Cl	5-CF ₃	
7-12	2-Cl	5-CF ₃	
7-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃	
7-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	
7-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-18	4-Br	5-CF ₃	
7-19	3-Br	5-CF ₃	
7-20	2-Br	5-CF ₃	
7-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃	
7-23	4-I	5-CF ₃	
7-24	3-I	5-CF ₃	
7-25	2-I	5-CF ₃	
7-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-27	4-CN	5-CF ₃	
7-28	3-CN	5-CF ₃	
7-29	2-CN	5-CF ₃	
7-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-31	4-NO ₂	5-CF ₃	
7-32	3-NO ₂	5-CF ₃	
7-33	2-NO ₂	5-CF ₃	

表 7 (続き)

化合物番号	R 1	R 2	物理定数 [] : 融点 °C
7-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃	
7-35	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-36	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃	
7-37	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-39	3-Me	5-CF ₃	
7-40	2-Me	5-CF ₃	
7-41	2, 4-Me ₂	5-CF ₃	
7-42	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃	
7-43	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-44	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃	
7-45	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-46	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃	
7-47	2-Me-4-F	5-CF ₃	
7-48	2-Me-4-Cl	5-CF ₃	
7-49	2-Et-4-Cl	5-CF ₃	
7-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃	
7-51	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-52	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-53	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-54	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-55	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-56	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-57	2-CH ₂ CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-58	2-CH ₂ CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-59	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-60	2-CH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-61	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-62	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-63	4-CF ₃	5-CF ₃	
7-64	3-CF ₃	5-CF ₃	
7-65	2-CF ₃	5-CF ₃	
7-66	3, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
7-67	3, 5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
7-68	2, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
7-69	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-70	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	

表 7 (続 き)

化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
7-71	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	
7-72	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃	
7-73	4-OMe	5-CF ₃	
7-74	3-OMe	5-CF ₃	
7-75	2-OMe	5-CF ₃	
7-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃	
7-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl	
7-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br	
7-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃	
7-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
7-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl	
7-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br	
7-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂	
7-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂	
7-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me	
7-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me	
7-89	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃	
7-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃	
7-91	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN	
7-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN	
7-93	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-94	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-95	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-96	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-97	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-98	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-99	2-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-100	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
7-101	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-102	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-103	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
7-104	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me	
7-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃	
7-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃	
7-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN	
7-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃	
7-109	2-OCH ₂ ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	

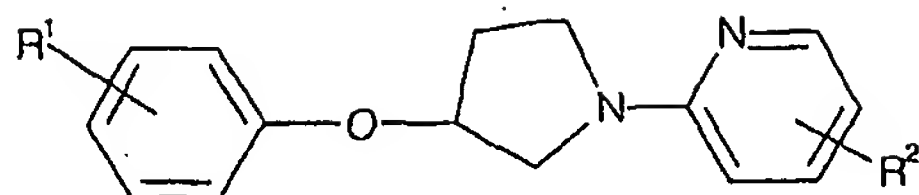
表 7 (続き)

化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
7-110	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-111	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	
7-112	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-113	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-114	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-115	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-116	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-117	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-118	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-119	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-120	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-121	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-122	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-123	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-124	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-125	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-126	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-127	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-128	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-129	4-OCF ₃	5-CF ₃	
7-130	3-OCF ₃	5-CF ₃	
7-131	2-OCF ₃	5-CF ₃	
7-132	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
7-133	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
7-134	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
7-135	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-136	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-137	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-138	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-139	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-140	2-Oallyenyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-141	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-142	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-143	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	

表7(続き)

化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
7-144	2-OCH ₂ CH=CM _e 2-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-145	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-146	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-147	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-148	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-149	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-150	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-151	2-SO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-152	2-OSO ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-153	2-OSO ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-154	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-155	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-156	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-157	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-158	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-159	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-160	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-161	2-NHSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-162	2-N(SO ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
7-163	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-164	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
7-165	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	

表8



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
8-1	4-OH	5-CF ₃		
8-2	3-OH	5-CF ₃		
8-3	2-OH	5-CF ₃		
8-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-5	4-F	5-CF ₃		
8-6	3-F	5-CF ₃		
8-7	2-F	5-CF ₃		
8-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
8-10	4-Cl	5-CF ₃		
8-11	3-Cl	5-CF ₃		
8-12	2-Cl	5-CF ₃		
8-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
8-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
8-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-18	4-Br	5-CF ₃		
8-19	3-Br	5-CF ₃		
8-20	2-Br	5-CF ₃		
8-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
8-23	4-I	5-CF ₃		
8-24	3-I	5-CF ₃		
8-25	2-I	5-CF ₃		
8-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-27	4-CN	5-CF ₃		
8-28	3-CN	5-CF ₃		
8-29	2-CN	5-CF ₃		
8-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-31	4-NO ₂	5-CF ₃		
8-32	3-NO ₂	5-CF ₃		
8-33	2-NO ₂	5-CF ₃		

表8(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 []: 融点 °C	備考
8-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		
8-35	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-36	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃		
8-37	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-38	4-Me	5-CF ₃		
8-39	3-Me	5-CF ₃		
8-40	2-Me	5-CF ₃		
8-41	2,4-Me ₂	5-CF ₃		
8-42	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃		
8-43	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-44	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃		
8-45	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-46	2,4,6-Me ₃	5-CF ₃		
8-47	2-Me-4-F	5-CF ₃		
8-48	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
8-49	2-Et-4-Cl	5-CF ₃		
8-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
8-51	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-52	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-53	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-54	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-55	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-56	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-57	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-58	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-59	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-60	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-61	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-62	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-63	4-CF ₃	5-CF ₃	[109-112]	
8-64	3-CF ₃	5-CF ₃		
8-65	2-CF ₃	5-CF ₃		
8-66	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
8-67	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
8-68	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
8-69	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-70	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		

表8(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
8-71	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
8-72	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
8-73	4-OMe	5-CF ₃		
8-74	3-OMe	5-CF ₃		
8-75	2-OMe	5-CF ₃		
8-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃		
8-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
8-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
8-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃		
8-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[47-50]	
8-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl		
8-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br		
8-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂		
8-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂		
8-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me		
8-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me		
8-89	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃		
8-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃		
8-91	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN		
8-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN		
8-93	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-94	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-95	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-96	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-97	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-98	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-99	2-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-100	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-101	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-102	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-103	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-104	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
8-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
8-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
8-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		
8-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		

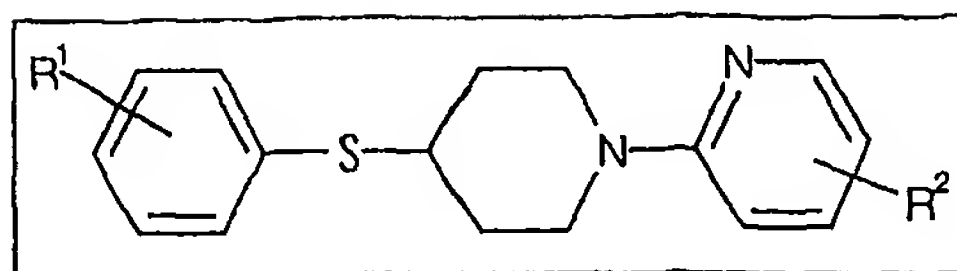
表8(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
8-109	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-110	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-111	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
8-112	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-113	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-114	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-115	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-116	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-117	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-118	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-119	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-120	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-121	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-122	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-123	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-124	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-125	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-126	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-127	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-128	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-129	4-OCF ₃	5-CF ₃	[35-38]	
8-130	3-OCF ₃	5-CF ₃		
8-131	2-OCF ₃	5-CF ₃		
8-132	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
8-133	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
8-134	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
8-135	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-136	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-137	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-138	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-139	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-140	2-Oallenyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-141	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-142	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		

表8(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
8-143	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-144	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-145	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-146	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-147	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-148	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-149	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-150	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-151	2-SO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-152	2-OSO ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-153	2-OSO ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-154	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-155	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-156	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-157	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-158	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-159	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-160	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-161	2-NHSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-162	2-N(SO ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
8-163	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-164	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
8-165	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		

表9



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
9-1	4-OH	5-CF ₃		
9-2	3-OH	5-CF ₃		
9-3	2-OH	5-CF ₃		
9-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-5	4-F	5-CF ₃		
9-6	3-F	5-CF ₃		
9-7	2-F	5-CF ₃		
9-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
9-10	4-Cl	5-CF ₃		
9-11	3-Cl	5-CF ₃		
9-12	2-Cl	5-CF ₃		
9-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-14	3-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-15	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
9-16	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-17	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
9-18	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-19	4-Br	5-CF ₃		
9-20	3-Br	5-CF ₃		
9-21	2-Br	5-CF ₃		
9-22	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-23	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
9-24	4-I	5-CF ₃		
9-25	3-I	5-CF ₃		
9-26	2-I	5-CF ₃		
9-27	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-28	2-CF ₃ -4-I	5-CF ₃		
9-29	4-CN	5-CF ₃		
9-30	3-CN	5-CF ₃		
9-31	2-CN	5-CF ₃		
9-32	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		

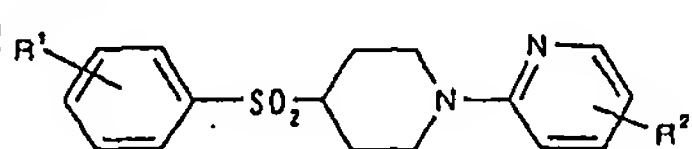
表9(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
9-33	2-CF ₃ -4-CN	5-CF ₃		
9-34	4-NO ₂	5-CF ₃		
9-35	3-NO ₂	5-CF ₃		
9-36	2-NO ₂	5-CF ₃		
9-37	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		
9-38	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-39	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃		
9-40	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-41	4-Me	5-CF ₃		
9-42	3-Me	5-CF ₃		
9-43	2-Me	5-CF ₃		
9-44	2, 4-Me ₂	5-CF ₃		
9-45	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-46	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃		
9-47	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃		
9-48	2-Me-4-F	5-CF ₃		
9-49	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
9-50	2-Me-4-Br	5-CF ₃		
9-51	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-52	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
9-53	2-Me-4-Br	5-CF ₃		
9-54	2-Et-4-Cl	5-CF ₃		
9-55	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-56	2-Et-4-OCF ₃	5-CF ₃		
9-57	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
9-58	2- ⁿ Pr-4-Br	5-CF ₃		
9-59	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-60	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-61	2- ⁱ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
9-62	2- ⁱ Pr-4-Br	5-CF ₃		
9-63	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-64	2-CH ₂ OMe-4-Cl	5-CF ₃		
9-65	2-CH ₂ OMe-4-Br	5-CF ₃		
9-66	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-67	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-68	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-69	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		

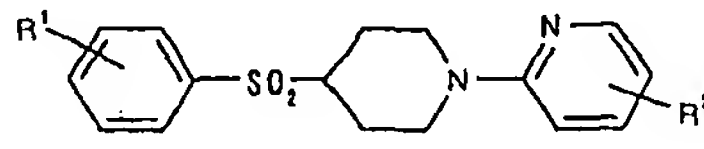
表9(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
9-70	3-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-71	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-72	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-73	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-74	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-75	4-CF ₃	5-CF ₃		
9-76	3-CF ₃	5-CF ₃		
9-77	2-CF ₃	5-CF ₃		
9-78	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
9-79	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
9-80	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
9-81	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-82	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-83	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	vis	
9-84	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	[131-133]	(注9-1)
9-85	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
9-86	4-OMe	5-CF ₃		
9-87	3-OMe	5-CF ₃		
9-88	2-OMe	5-CF ₃		
9-89	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-90	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-91	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
9-92	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
9-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
9-95	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[107-109]	(注9-2)
9-96	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[119-121]	(注9-3)
9-97	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-98	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-99	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-100	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-101	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-102	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-103	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-104	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		

(注9-1)



(注9-2)



(注9-3)

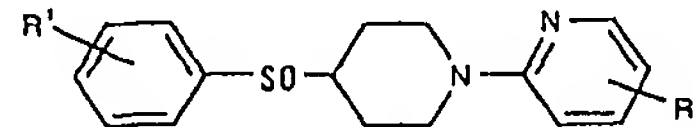


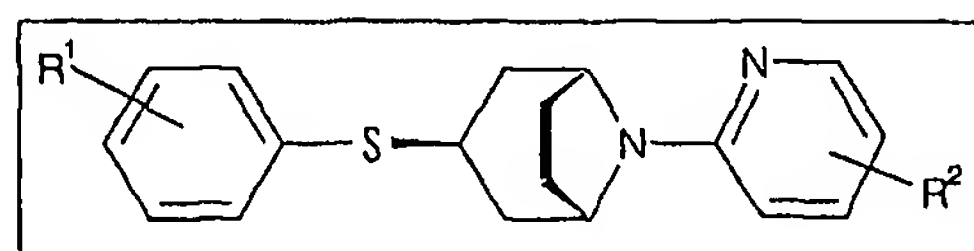
表9(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
9-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
9-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
9-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		
9-109	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		
9-110	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-111	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-112	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
9-113	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-114	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-115	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-116	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-117	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-118	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-119	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-120	2-OCH ₂ C(Me ₂)CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-121	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-122	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-123	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-124	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-125	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-126	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-127	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-128	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-129	4-OCF ₃	5-CF ₃		
9-130	3-OCF ₃	5-CF ₃		
9-131	2-OCF ₃	5-CF ₃		
9-132	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
9-133	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
9-134	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
9-135	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-136	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-137	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-138	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-139	2-Oallynyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-140	4-CO ₂ Me	5-CF ₃		

表9(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
9-141	3-CO ₂ Me	5-CF ₃		
9-142	2-CO ₂ Me	5-CF ₃		
9-143	4-SCF ₃	5-CF ₃		
9-144	3-SCF ₃	5-CF ₃		
9-145	2-SCF ₃	5-CF ₃		
9-146	4-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
9-147	3-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
9-148	2-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
9-149	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
9-150	3-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
9-151	2-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
9-152	4-OC(O)Ph	5-CF ₃		
9-153	3-OC(O)Ph	5-CF ₃		
9-154	2-OC(O)Ph	5-CF ₃		
9-155	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
9-156	3-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
9-157	2-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
9-158	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃		
9-159	2-Propargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-160	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-161	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃		
9-162	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃		
9-163	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-164	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃		
9-165	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-166	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
9-167	2-NHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-168	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-169	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-170	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
9-171	2-N(Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-172	2-OC(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-173	2-OC(O)SMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
9-174	3-CF ₃ -4-N(SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃		
9-175	2-C(O)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		

表 10



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
10-1	4-OH	5-CF ₃		
10-2	3-OH	5-CF ₃		
10-3	2-OH	5-CF ₃		
10-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-5	4-F	5-CF ₃		
10-6	3-F	5-CF ₃		
10-7	2-F	5-CF ₃		
10-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
10-10	4-Cl	5-CF ₃		
10-11	3-Cl	5-CF ₃		
10-12	2-Cl	5-CF ₃		
10-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-14	3-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-15	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
10-16	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-17	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
10-18	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-19	4-Br	5-CF ₃		
10-20	3-Br	5-CF ₃		
10-21	2-Br	5-CF ₃		
10-22	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-23	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
10-24	4-I	5-CF ₃		
10-25	3-I	5-CF ₃		
10-26	2-I	5-CF ₃		
10-27	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-28	2-CF ₃ -4-I	5-CF ₃		
10-29	4-CN	5-CF ₃		
10-30	3-CN	5-CF ₃		
10-31	2-CN	5-CF ₃		
10-32	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-33	2-CF ₃ -4-CN	5-CF ₃		

表10(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
10-34	4-N02	5-CF3		
10-35	3-N02	5-CF3		
10-36	2-N02	5-CF3		
10-37	2-Cl-4-CF3-6-N02	5-CF3		
10-38	2-N02-4-CF3	5-CF3		
10-39	3-CF3-4-N02	5-CF3		
10-40	2-CHO-4-CF3	5-CF3		
10-41	4-Me	5-CF3		
10-42	3-Me	5-CF3		
10-43	2-Me	5-CF3		
10-44	2, 4-Me2	5-CF3		
10-45	2-Me-4-CF3	5-CF3		
10-46	2-Me-4-OCF3	5-CF3		
10-47	2, 4, 6-Me3	5-CF3		
10-48	2-Me-4-F	5-CF3		
10-49	2-Me-4-Cl	5-CF3		
10-50	2-Me-4-Br	5-CF3		
10-51	2-Et-4-CF3	5-CF3		
10-52	2-Me-4-Cl	5-CF3		
10-53	2-Me-4-Br	5-CF3		
10-54	2-Et-4-Cl	5-CF3		
10-55	2-Et-4-CF3	5-CF3		
10-56	2-Et-4-OCF3	5-CF3		
10-57	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF3		
10-58	2- ⁿ Pr-4-Br	5-CF3		
10-59	2- ⁿ Pr-4-CF3	5-CF3		
10-60	2- ⁱ Pr-4-CF3	5-CF3		
10-61	2- ⁱ Pr-4-Cl	5-CF3		
10-62	2- ⁱ Pr-4-Br	5-CF3		
10-63	2-CH2OMe-4-CF3	5-CF3		
10-64	2-CH2OMe-4-Cl	5-CF3		
10-65	2-CH2OMe-4-Br	5-CF3		
10-66	2-CH2OEt-4-CF3	5-CF3		
10-67	2-CH(OH)Et-4-CF3	5-CF3		

表10(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
10-68	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-69	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-70	3-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-71	2-CH ₂ OCH ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-72	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-73	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-74	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-75	4-CF ₃	5-CF ₃		
10-76	3-CF ₃	5-CF ₃		
10-77	2-CF ₃	5-CF ₃		
10-78	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
10-79	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
10-80	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
10-81	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-82	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-83	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
10-84	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
10-85	4-OMe	5-CF ₃		
10-86	3-OMe	5-CF ₃		
10-87	2-OMe	5-CF ₃		
10-88	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-89	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-90	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
10-91	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
10-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-93	2-OnPr-4-CF ₃	5-CF ₃	[72-74]	
10-94	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-95	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-96	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-97	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-98	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-99	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-100	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-101	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-102	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
10-103	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
10-104	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
10-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		

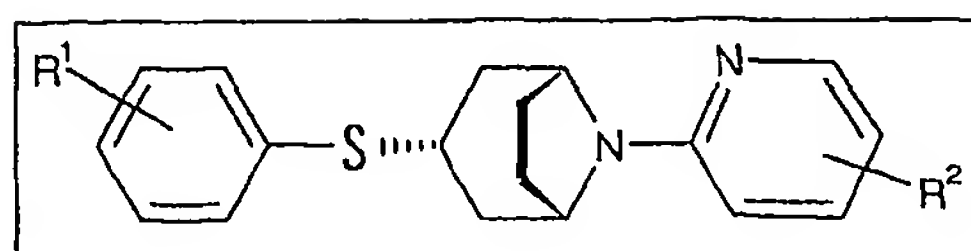
表10(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
10-106	2-OCH ₂ ^t Pr-4-CN	5-CF ₃		
10-107	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-108	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-109	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
10-110	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-111	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-112	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-113.	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-114	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-115	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-116	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-117	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-118	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-119	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-120	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-121	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-122	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-123	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-124	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-125	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-128	4-OCF ₃	5-CF ₃		
10-129	3-OCF ₃	5-CF ₃		
10-130	2-OCF ₃	5-CF ₃		
10-131	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
10-132	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
10-133	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
10-134	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-135	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-136	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-137	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-138	2-Oallyenyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-139	4-CO ₂ Me	5-CF ₃		
10-140	3-CO ₂ Me	5-CF ₃		
10-141	2-CO ₂ Me	5-CF ₃		
10-142	4-SCF ₃	5-CF ₃		
10-143	3-SCF ₃	5-CF ₃		
10-144	2-SCF ₃	5-CF ₃		

表10(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
10-145	4-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
10-146	3-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
10-147	2-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
10-148	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
10-149	3-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
10-150	2-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
10-151	4-OC(O)Ph	5-CF ₃		
10-152	3-OC(O)Ph	5-CF ₃		
10-153	2-OC(O)Ph	5-CF ₃		
10-154	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
10-155	3-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
10-156	2-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
10-157	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃		
10-158	2-Propargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-159	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-160	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃		
10-161	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃		
10-162	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-163	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃		
10-164	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-165	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
10-166	2-NHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-167	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-168	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-169	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
10-170	2-N(Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-171	2-OC(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-172	2-OC(O)SMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
10-173	3-CF ₃ -4-N(SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃		
10-174	2-C(O)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		

表11



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
11-1	4-OH	5-CF ₃		
11-2	3-OH	5-CF ₃		
11-3	2-OH	5-CF ₃		
11-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-5	4-F	5-CF ₃		
11-6	3-F	5-CF ₃		
11-7	2-F	5-CF ₃		
11-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
11-10	4-Cl	5-CF ₃		
11-11	3-Cl	5-CF ₃		
11-12	2-Cl	5-CF ₃		
11-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-14	3-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-15	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
11-16	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-17	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
11-18	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-19	4-Br	5-CF ₃		
11-20	3-Br	5-CF ₃		
11-21	2-Br	5-CF ₃		
11-22	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-23	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
11-24	4-I	5-CF ₃		
11-25	3-I	5-CF ₃		
11-26	2-I	5-CF ₃		
11-27	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-28	2-CF ₃ -4-I	5-CF ₃		
11-29	4-CN	5-CF ₃		
11-30	3-CN	5-CF ₃		
11-31	2-CN	5-CF ₃		
11-32	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-33	2-CF ₃ -4-CN	5-CF ₃		

表11(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
11-34	4-NO ₂	5-CF ₃		
11-35	3-NO ₂	5-CF ₃		
11-36	2-NO ₂	5-CF ₃		
11-37	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		
11-38	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-39	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃		
11-40	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-41	4-Me	5-CF ₃		
11-42	3-Me	5-CF ₃		
11-43	2-Me	5-CF ₃		
11-44	2, 4-Me ₂	5-CF ₃		
11-45	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-46	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃		
11-47	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃		
11-48	2-Me-4-F	5-CF ₃		
11-49	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
11-50	2-Me-4-Br	5-CF ₃		
11-51	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-52	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
11-53	2-Me-4-Br	5-CF ₃		
11-54	2-Et-4-Cl	5-CF ₃		
11-55	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-56	2-Et-4-OCF ₃	5-CF ₃		
11-57	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
11-58	2- ⁿ Pr-4-Br	5-CF ₃		
11-59	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-60	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-61	2- ⁱ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
11-62	2- ⁱ Pr-4-Br	5-CF ₃		
11-63	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-64	2-CH ₂ OMe-4-Cl	5-CF ₃		
11-65	2-CH ₂ OMe-4-Br	5-CF ₃		
11-66	2-CH ₂ OE _t -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-67	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-68	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-69	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-70	3-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		

表11(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
11-71	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-72	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-73	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-74	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-75	4-CF ₃	5-CF ₃		
11-76	3-CF ₃	5-CF ₃		
11-77	2-CF ₃	5-CF ₃		
11-78	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
11-79	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
11-80	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
11-81	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-82	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-83	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
11-84	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
11-85	4-OMe	5-CF ₃		
11-86	3-OMe	5-CF ₃		
11-87	2-OMe	5-CF ₃		
11-88	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-89	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-90	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
11-91	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
11-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis	
11-94	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-95	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-96	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-97	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-98	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-99	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-100	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-101	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-102	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
11-103	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
11-104	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
11-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		
11-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		
11-107	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-108	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-109	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		

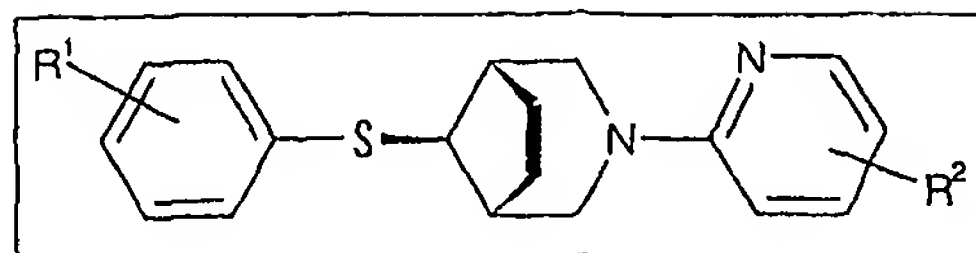
表11(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
11-110	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-111	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-112	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-113	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-114	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-115	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-116	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-117	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-118	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-119	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-120	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-121	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-122	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-123	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-124	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-125	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-128	4-OCF ₃	5-CF ₃		
11-129	3-OCF ₃	5-CF ₃		
11-130	2-OCF ₃	5-CF ₃		
11-131	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
11-132	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
11-133	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
11-134	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-135	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-136	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-137	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-138	2-Oallynyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-139	4-CO ₂ Me	5-CF ₃		
11-140	3-CO ₂ Me	5-CF ₃		

表11(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
11-141	2-CO ₂ Me	5-CF ₃		
11-142	4-SCF ₃	5-CF ₃		
11-143	3-SCF ₃	5-CF ₃		
11-144	2-SCF ₃	5-CF ₃		
11-145	4-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
11-146	3-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
11-147	2-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
11-148	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
11-149	3-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
11-150	2-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
11-151	4-OC(O)Ph	5-CF ₃		
11-152	3-OC(O)Ph	5-CF ₃		
11-153	2-OC(O)Ph	5-CF ₃		
11-154	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
11-155	3-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
11-156	2-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
11-157	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃		
11-158	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-159	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-160	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃		
11-161	2,3,6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃		
11-162	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-163	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃		
11-164	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-165	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
11-166	2-NHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-167	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-168	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-169	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
11-170	2-N(Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-171	2-OC(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-172	2-OC(O)SMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
11-173	3-CF ₃ -4-N(SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃		
11-174	2-C(O)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		

表12



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
12-1	4-OH	5-CF ₃		
12-2	3-OH	5-CF ₃		
12-3	2-OH	5-CF ₃		
12-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-5	4-F	5-CF ₃		
12-6	3-F	5-CF ₃		
12-7	2-F	5-CF ₃		
12-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃		
12-10	4-Cl	5-CF ₃		
12-11	3-Cl	5-CF ₃		
12-12	2-Cl	5-CF ₃		
12-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-14	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-15	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃		
12-16	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-17	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
12-18	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-19	4-Br	5-CF ₃		
12-20	3-Br	5-CF ₃		
12-21	2-Br	5-CF ₃		
12-22	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-23	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃		
12-24	4-I	5-CF ₃		
12-25	3-I	5-CF ₃		
12-26	2-I	5-CF ₃		
12-27	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-28	2-CF ₃ -4-I	5-CF ₃		
12-29	4-CN	5-CF ₃		
12-30	3-CN	5-CF ₃		
12-31	2-CN	5-CF ₃		
12-32	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-33	2-CF ₃ -4-CN	5-CF ₃		

表12(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
12-34	4-NO ₂	5-CF ₃		
12-35	3-NO ₂	5-CF ₃		
12-36	2-NO ₂	5-CF ₃		
12-37	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃		
12-38	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-39	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃		
12-40	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-41	4-Me	5-CF ₃		
12-42	3-Me	5-CF ₃		
12-43	2-Me	5-CF ₃		
12-44	2, 4-Me ₂	5-CF ₃		
12-45	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-46	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃		
12-47	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃		
12-48	2-Me-4-F	5-CF ₃		
12-49	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
12-50	2-Me-4-Br	5-CF ₃		
12-51	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-52	2-Me-4-Cl	5-CF ₃		
12-53	2-Me-4-Br	5-CF ₃		
12-54	2-Et-4-Cl	5-CF ₃		
12-55	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-56	2-Et-4-OCF ₃	5-CF ₃		
12-57	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
12-58	2- ⁿ Pr-4-Br	5-CF ₃		
12-59	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-60	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-61	2- ⁱ Pr-4-Cl	5-CF ₃		
12-62	2- ⁱ Pr-4-Br	5-CF ₃		
12-63	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-64	2-CH ₂ OMe-4-Cl	5-CF ₃		
12-65	2-CH ₂ OMe-4-Br	5-CF ₃		
12-66	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-67	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-68	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-69	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-70	3-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		

表12(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
12-71	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-72	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-73	2-CH(Me)OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-74	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-75	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-76	4-CF ₃	5-CF ₃		
12-77	3-CF ₃	5-CF ₃		
12-78	2-CF ₃	5-CF ₃		
12-79	3,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
12-80	3,5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
12-81	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃		
12-82	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-83	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-84	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃		
12-85	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃		
12-86	4-OMe	5-CF ₃		
12-87	3-OMe	5-CF ₃		
12-88	2-OMe	5-CF ₃		
12-89	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-90	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-91	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl		
12-92	2-OEt-4-CF ₃	5-Br		
12-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CH ₂ F		
12-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me		
12-95	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[94-96]	
12-96	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN		
12-97	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-98	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CHF ₂		
12-99	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CHO		
12-100	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CH ₂ OH		
12-101	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃		
12-102	3-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃		
12-103	2-(O ^c Pr-2,2-Cl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-104	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-105	2-OBn-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-106	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-107	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-108	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃		

表12(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
12-109	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-110	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
12-111	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-112	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-113	2-OCH ₂ CH(Me)OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-114	2-OCH ₂ C(Me) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-115	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-116	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me		
12-117	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃		
12-118	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃		
12-119	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN		
12-120	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃		
12-121	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-122	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-123	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-124	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN		
12-125	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-126	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-127	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-128	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-129	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-130	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-131	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-132	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-133	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-134	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-135	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-136	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-137	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-138	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-139	4-OCF ₃	5-CF ₃		
12-140	3-OCF ₃	5-CF ₃		
12-141	2-OCF ₃	5-CF ₃		
12-142	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
12-143	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃		
12-144	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃		

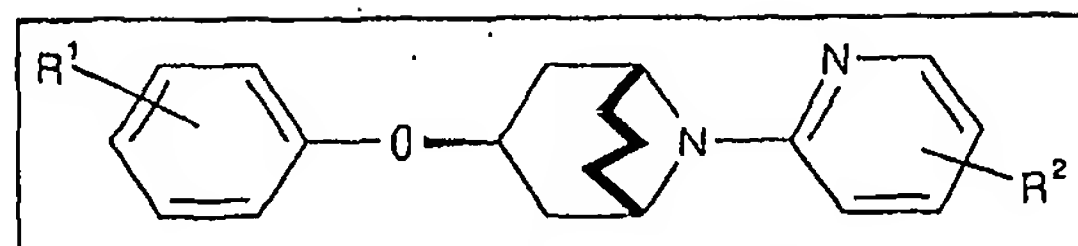
表12(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
12-145	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-146	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-147	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-148	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-149	2-Oallynyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-150	4-CO ₂ Me	5-CF ₃		
12-151	3-CO ₂ Me	5-CF ₃		
12-152	2-CO ₂ Me	5-CF ₃		
12-153	4-SCF ₃	5-CF ₃		
12-154	3-SCF ₃	5-CF ₃		
12-155	2-SCF ₃	5-CF ₃		
12-156	4-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
12-157	3-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
12-158	2-S(O)CF ₃	5-CF ₃		
12-159	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
12-160	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-161	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-162	2-OSO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-163	2-OSO ₂ ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-164	3-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
12-165	2-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃		
12-166	4-OC(O)Ph	5-CF ₃		
12-167	3-OC(O)Ph	5-CF ₃		
12-168	2-OC(O)Ph	5-CF ₃		
12-169	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
12-170	3-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		

表12(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C	備考
12-171	2-OCH ₂ Ph	5-CF ₃		
12-172	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃		
12-173	2-OCH ₂ C (Me) =CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-174	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-175	2-O (CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-176	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-177	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-178	2, 3, 6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃		
12-179	2, 3, 6-Cl ₃ -4-OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃		
12-180	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-181	2-OCH ₂ C (=NOH) Me-4-CHO (anti)	5-CF ₃		
12-182	2-OCH ₂ C (=NOH) Me-4-CHO (syn)	5-CF ₃		
12-183	2-OCH ₂ C (=NOMe) Me-4-CHO (anti)	5-CF ₃		
12-184	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃		
12-185	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-186	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃		
12-187	2-NHMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-188	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-189	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-190	2-N (Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-191	2-N (ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃		
12-192	2-NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-193	2-N (Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-194	2-OC (O) OMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-195	2-OC (O) SMe-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-196	3-CF ₃ -4-N (SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃		
12-197	2-OC (O) Et-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-198	2-OC (O) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-199	2-OC (O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-200	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃		
12-201	2-(O ^c Pr-2, 2-Cl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃		

表 13



化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
13-1	4-OH	5-CF ₃	
13-2	3-OH	5-CF ₃	
13-3	2-OH	5-CF ₃	
13-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-5	4-F	5-CF ₃	
13-6	3-F	5-CF ₃	
13-7	2-F	5-CF ₃	
13-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃	
13-10	4-Cl	5-CF ₃	
13-11	3-Cl	5-CF ₃	
13-12	2-Cl	5-CF ₃	
13-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃	
13-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	
13-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-18	4-Br	5-CF ₃	
13-19	3-Br	5-CF ₃	
13-20	2-Br	5-CF ₃	
13-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃	
13-23	4-I	5-CF ₃	
13-24	3-I	5-CF ₃	
13-25	2-I	5-CF ₃	
13-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-27	4-CN	5-CF ₃	
13-28	3-CN	5-CF ₃	
13-29	2-CN	5-CF ₃	
13-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-31	4-NO ₂	5-CF ₃	
13-32	3-NO ₂	5-CF ₃	
13-33	2-NO ₂	5-CF ₃	

表13(続き)

化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
13-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃	
13-35	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-36	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃	
13-37	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-38	3-Me	5-CF ₃	
13-39	2-Me	5-CF ₃	
13-40	2, 4-Me ₂	5-CF ₃	
13-41	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃	
13-42	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-43	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃	
13-44	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-45	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃	
13-46	2-Me-4-F	5-CF ₃	
13-47	2-Me-4-Cl	5-CF ₃	
13-48	2-Et-4-Cl	5-CF ₃	
13-49	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃	
13-50	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-51	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-52	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-53	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-54	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-55	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-56	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-57	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-58	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-59	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-60	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-61	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-62	4-CF ₃	5-CF ₃	
13-63	3-CF ₃	5-CF ₃	
13-64	2-CF ₃	5-CF ₃	
13-65	3, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
13-66	3, 5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
13-67	2, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
13-68	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-69	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-70	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	
13-71	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃	

表13(続き)

化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
13-72	4-OMe	5-CF ₃	
13-73	3-OMe	5-CF ₃	
13-74	2-OMe	5-CF ₃	
13-75	2-OMe-4-CN	5-CF ₃	
13-76	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-77	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-78	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl	
13-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Br	
13-80	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃	
13-81	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	N d22.2-1.5140
13-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl	
13-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br	
13-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂	
13-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂	
13-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me	
13-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me	
13-88	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃	
13-89	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃	
13-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN	
13-91	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN	
13-92	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-93	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-94	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-95	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-96	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-97	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-98	2-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-99	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-100	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-101	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-102	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-103	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me	
13-104	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃	
13-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃	
13-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN	
13-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃	
13-108	2-OCH ₂ ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-109	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-110	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	

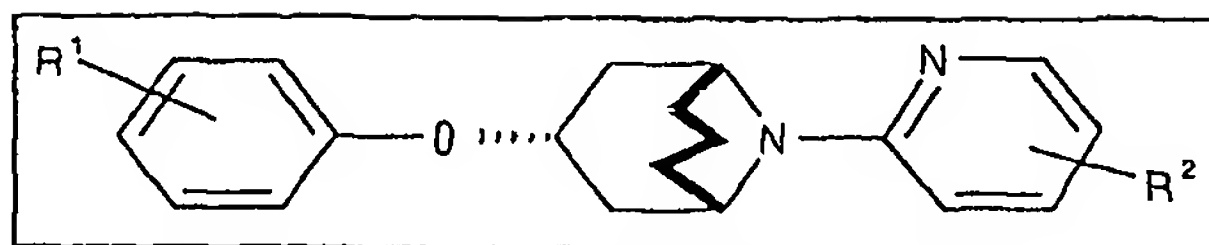
表13(続き)

化合物番号	R ₁	R ₂	物理定数 [] : 融点 °C
13-111	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-112	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-113	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-114	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-115	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-116	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-117	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-118	2-OCH ₂ C(Me) ₂ CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-119	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-120	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-121	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-122	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-123	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-124	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-125	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-126	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-127	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-128	4-OCF ₃	5-CF ₃	
13-129	3-OCF ₃	5-CF ₃	
13-130	2-OCF ₃	5-CF ₃	
13-131	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
13-132	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
13-133	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
13-134	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-135	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-136	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-137	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-138	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-139	2-Oallenyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-140	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-141	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-142	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-143	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-144	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-145	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-146	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	

表13(続き)

化合物番号	R 1	R 2	物理定数 [] : 融点 °C
13-147	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-148	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-149	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-150	2-SO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-151	2-OSO ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-152	2-OSO ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-153	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-154	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-155	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-156	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-157	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-158	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-159	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-160	2-NHSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-161	2-N(SO ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
13-162	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-163	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
13-164	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	

表 14



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
14-1	4-OH	5-CF ₃	
14-2	3-OH	5-CF ₃	
14-3	2-OH	5-CF ₃	
14-4	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-5	4-F	5-CF ₃	
14-6	3-F	5-CF ₃	
14-7	2-F	5-CF ₃	
14-8	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-9	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃	
14-10	4-Cl	5-CF ₃	
14-11	3-Cl	5-CF ₃	
14-12	2-Cl	5-CF ₃	
14-13	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-14	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃	
14-15	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-16	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	
14-17	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-18	4-Br	5-CF ₃	
14-19	3-Br	5-CF ₃	
14-20	2-Br	5-CF ₃	
14-21	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-22	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃	
14-23	4-I	5-CF ₃	
14-24	3-I	5-CF ₃	
14-25	2-I	5-CF ₃	
14-26	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-27	4-CN	5-CF ₃	
14-28	3-CN	5-CF ₃	
14-29	2-CN	5-CF ₃	
14-30	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-31	4-NO ₂	5-CF ₃	
14-32	3-NO ₂	5-CF ₃	
14-33	2-NO ₂	5-CF ₃	

表14(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
14-34	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃	
14-35	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-36	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃	
14-37	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-38	4-Me	5-CF ₃	
14-39	3-Me	5-CF ₃	
14-40	2-Me	5-CF ₃	
14-41	2, 4-Me ₂	5-CF ₃	
14-42	2-Me-3-CF ₃	5-CF ₃	
14-43	2-Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-44	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃	
14-45	2-Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-46	2, 4, 6-Me ₃	5-CF ₃	
14-47	2-Me-4-F	5-CF ₃	
14-48	2-Me-4-Cl	5-CF ₃	
14-49	2-Et-4-Cl	5-CF ₃	
14-50	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃	
14-51	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-52	2- ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-53	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-54	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-55	2-CH(OH)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-56	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-57	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-58	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-59	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-60	2-CH ₂ OCH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-61	2-CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-62	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-63	4-CF ₃	5-CF ₃	
14-64	3-CF ₃	5-CF ₃	
14-65	2-CF ₃	5-CF ₃	
14-66	3, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
14-67	3, 5-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	

表 14(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
14-68	2, 4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	
14-69	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-70	2-CH(Cl)Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-71	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	
14-72	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃	
14-73	4-OMe	5-CF ₃	
14-74	3-OMe	5-CF ₃	
14-75	2-OMe	5-CF ₃	
14-76	2-OMe-4-CN	5-CF ₃	
14-77	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-78	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-79	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl	
14-80	2-OEt-4-CF ₃	5-Br	
14-81	2-O ⁿ Pr-4-CN	5-CF ₃	
14-82	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
14-83	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-84	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-85	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Cl	
14-86	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Br	
14-87	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NO ₂	
14-88	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NH ₂	
14-89	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-Me	
14-90	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-NHSO ₂ Me	
14-91	2-O ⁿ Pr-5-CF ₃	5-CF ₃	
14-92	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	6-CF ₃	
14-93	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CN	
14-94	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃ -6-CN	
14-95	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-96	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-97	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-98	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-99	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-100	2-O ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-101	2-OCH ₂ CN-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-102	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-103	2-OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-104	2-OCH ₂ O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	

表 14(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
14-105	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-106	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CO ₂ Me	
14-107	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHF ₂	5-CF ₃	
14-108	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CHO	5-CF ₃	
14-109	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CN	
14-110	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CN	5-CF ₃	
14-111	2-OCH ₂ ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-112	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-113	2-O(CH ₂) ₂ OMe-4-CF ₃	5-CN	
14-114	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-115	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-116	2-OCH ₂ Ac-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-117	2-OCH ₂ CH(OH)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-118	2-OCH ₂ CH(OMe)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-119	2-OCH ₂ C(OH)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-120	2-OCH ₂ C(OMe)Me ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-121	2-OCH ₂ C(Me ₂)CO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-122	2-OCH ₂ C(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-123	2-OCH ₂ C(O)OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-124	2-O(CH ₂) ₂ OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-125	2-O(CH ₂) ₂ NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-126	2-O(CH ₂) ₂ NHAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-127	2-O(CH ₂) ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-128	2-OCH ₂ CH(Cl)Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-129	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-130	2-OCH ₂ CH(Me)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-131	4-OCF ₃	5-CF ₃	
14-132	3-OCF ₃	5-CF ₃	
14-133	2-OCF ₃	5-CF ₃	
14-134	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
14-135	3-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
14-136	2-OCF ₂ Br	5-CF ₃	
14-137	2-O(CH ₂) ₂ Br-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-138	2-O(CH ₂) ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-139	2-O(CH ₂) ₂ F-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-140	2-OCH ₂ (Ph-4-Cl)-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-141	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-142	2-Oallenyl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-143	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	

表14(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
14-144	2-O(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-145	2-OCH ₂ CH=CHMe-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-146	2-OCH ₂ CH=CMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-147	2-OCH ₂ C(Me)=CH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-148	2-OCH ₂ CH=CHCl-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-149	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-150	2-OC(O) ^t Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-151	2-OSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-152	2-OSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-153	2-SO ₂ ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-154	2-OSO ₂ ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-155	2-OSO ₂ NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-156	2-OC(S)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-157	2-SC(O)NMe ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-158	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-159	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-160	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-161	2-N(Me) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-162	2-NHSO ₂ Me-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-163	2-NHSO ₂ Et-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-164	2-N(SO ₂ ⁿ Bu) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	
14-165	2-S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-166	2-SCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	
14-167	2-OP(O)(OEt)S ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	

NMRデータ

¹H-NMR (CDCl₃)

化合物番号 1-169

δ 1.85-1.95 (m, 2H), 2.05-2.24 (m, 2H), 3.57-3.65 (m, 2H), 3.93-4.01 (m, 4H), 4.62-4.69 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.96 (a set of s and d, 2H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-80

δ 1.98-2.05 (m, 4H), 3.69-3.78 (m, 2H), 3.86-3.94 (m, 2H), 4.82-4.86 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-143

δ 1.89-2.06 (m, 4H), 3.61-3.70 (m, 2H), 3.91-4.00 (m, 2H), 4.63-4.67 (m, 1H), 5.42 (d, 2H), 6.68 (d, 1H), 6.85 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-163

δ 1.86-2.09 (m, 4H), 2.53 (t, 1H), 3.57-3.66 (m, 2H), 3.94-4.03 (m, 2H), 4.60-4.67 (m, 1H), 4.77 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.24-7.29 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-172

δ 1.29 (t, 3H), 1.83-1.94 (m, 2H), 2.04-2.14 (m, 2H), 3.15-3.24 (m, 2H), 3.53-3.62 (m, 2H), 3.95-4.01 (m, 2H), 4.23 (br s, 1H), 4.61-4.6

7 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77-6.89 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-69

δ 1.88-2.09 (m, 4H), 3.41 (s, 3H), 3.66-3.74 (m, 2H), 3.84-3.93 (m, 2H), 4.66 (s, 2H), 4.68-4.75 (m, 3H), 6.68 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-173

δ 1.00 (t, 3H), 1.67 (q, 2H), 1.86-1.93 (m, 2H), 2.06-2.12 (m, 2H), 3.07-3.15 (m, 2H), 3.55-3.63 (m, 2H), 3.93-4.01 (m, 2H), 4.32 (brs, 1H), 4.64-4.66 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77-6.90 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-140

δ 1.87-2.06 (m, 4H), 3.60-3.68 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 3.86-3.99 (m, 2H), 4.30 (t, 2H), 4.63-4.68 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-74

δ 1.91-2.08 (m, 4H), 3.42 (d, 2H), 3.74-3.86 (m, 4H), 4.69-4.71 (m, 1H), 5.04-5.10 (m, 2H), 5.91-6.00 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 1-67

δ 0.97 (t, 3H), 1.74-1.95 (m, 4H), 2.04-2.14 (m,

3 H), 3. 6 6-3. 7 3 (m, 2 H), 3. 8 5-3. 9 4 (m, 2 H), 4. 7 1-4. 7 4 (m, 1 H), 4. 9 3-4. 9 6 (m, 1 H), 6. 6 9 (d, 1 H), 6. 9 4 (d, 1 H), 7. 4 9 (d, 1 H), 7. 6 4 (d, 1 H), 7. 6 9 (s, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物番号 2-57

δ 2. 0 0-2. 3 1 (m, 8 H), 3. 4 4 (s, 3 H), 4. 5 8-4. 6 4 (m, 3 H), 4. 7 0 (s, 2 H), 4. 7 9 (s, 2 H), 6. 5 7 (d, 1 H), 6. 7 2 (d, 1 H), 7. 5 0 (d, 1 H), 7. 6 3 (d, 1 H), 7. 7 2 (s, 1 H), 8. 4 1 (s, 1 H)

化合物番号 2-58

δ 1. 2 5 (t, 3 H), 2. 0 0-2. 2 9 (m, 8 H), 3. 6 8 (q, 2 H), 4. 5 8-4. 6 4 (m, 3 H), 4. 7 1 (s, 2 H), 4. 8 4 (s, 2 H), 6. 5 7 (d, 1 H), 6. 7 2 (d, 1 H), 7. 4 9 (d, 1 H), 7. 6 3 (d, 1 H), 7. 7 2 (s, 1 H), 8. 4 1 (s, 1 H)

化合物番号 2-78

δ 1. 4 6 (t, 3 H), 2. 0 0-2. 2 1 (m, 6 H), 2. 4 4-2. 4 6 (m, 2 H), 4. 1 0 (q, 2 H), 4. 5 5 (b r s, 2 H), 4. 6 1 (b r s, 1 H), 6. 5 6 (d, 1 H), 6. 7 8 (d, 1 H), 7. 0 8 (d, 1 H), 7. 1 5 (d, 1 H), 7. 6 0 (d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物番号 2-141

δ 2. 0 1-2. 3 1 (m, 6 H), 2. 4 0-2. 4 7 (m, 2 H), 4. 5 6-4. 6 3 (m, 5 H), 5. 3 2 (d, 1 H), 5. 4 6 (d, 1 H), 6. 0 1-6. 1 4 (m, 1 H), 6. 5 5 (d, 1 H), 6. 7 8 (d, 1 H), 7. 1 1 (s, 1 H), 7. 1 7 (d, 1 H), 7. 6 1 (d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物番号 3-62

δ 1. 78-1. 93 (m, 4H), 2. 14-2. 19 (m, 4H), 3. 28 (d, 2H), 4. 69 (brs, 2H), 4. 83-4. 90 (m, 1H), 4. 95-5. 02 (m, 2H), 5. 77-5. 91 (m, 1H), 6. 59 (d, 1H), 6. 92 (d, 1H), 7. 35 (s, 1H), 7. 41 (d, 1H), 7. 65 (d, 1H), 8. 43 (s, 1H)

化合物番号 2-148

δ 2. 00-2. 23 (m, 6H), 2. 35-2. 44 (m, 2H), 4. 56-4. 61 (m, 4H), 4. 82 (q, 1H), 6. 06-6. 64 (m, 2H), 6. 56 (d, 1H), 6. 78 (d, 1H), 7. 12 (d, 1H), 7. 20 (d, 1H), 7. 61 (d, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物番号 2-144

δ 1. 99-2. 20 (m, 6H), 2. 40-2. 47 (m, 2H), 2. 57-2. 64 (m, 2H), 4. 07 (t, 2H), 4. 55-4. 60 (m, 3H), 5. 14 (dd, 2H), 5. 86-5. 99 (m, 1H), 6. 56 (d, 1H), 6. 77 (d, 1H), 7. 08 (s, 1H), 7. 12 (d, 1H), 7. 60 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物番号 2-115

δ 2. 00-2. 30 (m, 7H), 2. 35-2. 44 (m, 2H), 3. 97-4. 03 (m, 2H), 4. 16 (t, 2H), 4. 52-4. 65 (brs, plus t, 3H), 6. 56 (d, 1H), 6. 78 (d, 1H), 7. 14 (s, 1H), 7. 19 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物番号 2-153

δ 1. 05 (t, 3H), 1. 76-1. 84 (m, 2H), 2. 03 (d, 2H), 2. 17-2. 20 (m, 2H), 2. 36-2. 40 (m, 4H), 3. 36 (t, 2H), 4. 61 (brs, 2H), 4. 72 (t, 1H), 6. 58 (d, 1H), 6. 92 (d, 1H), 7. 64 (d, 1H), 7. 80 (d, 1H), 8. 28 (s,

1 H), 8.42 (s, 1 H)

化合物番号 2-112

δ 2.00-2.21 (m, 6H), 2.39-2.47 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.79 (t, 2H), 4.16 (t, 2H), 4.56 (brs, 2H), 4.62 (brs, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-161

δ 0.89 (t, 3H), 1.47-1.63 (m, 2H), 2.07-2.11 (m, 4H), 2.19-2.27 (m, 2H), 2.38-2.45 (m, 2H), 2.80 (s, 3H), 3.08 (t, 2H), 4.56 (brs, 2H), 4.60 (t, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-143

δ 2.00-2.24 (m, 6H), 2.38-2.45 (m, 2H), 2.54-2.56 (m, 1H), 4.56-4.63 (brs plus t, 3H), 4.77 (d, 2H), 6.56 (d, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-138

δ 2.05-2.26 (m, 6H), 2.41-2.48 (m, 2H), 3.87 (t, 2H), 4.31 (t, 2H), 4.61-4.64 (brs plus t, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-101

δ 2.11-2.40 (m, 8H), 4.58 (brs, 2H), 4.65 (t,

1 H), 4. 8 6 (s, 2 H), 6. 5 7 (d, 1 H), 6. 7 3 (d, 1 H), 7. 2 7 (s, 1 H), 7. 3 7 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 4 1 (s, 1 H)

化合物番号 5-175

δ 1. 5 7-1. 6 4 (m, 2 H), 1. 7 5 (d, 3 H), 2. 0 3-2. 0 6 (m, 2 H), 2. 5 8 (br s, 2 H), 3. 0 8 (d, 2 H), 4. 1 8 (dd, 2 H), 4. 5 1 (d, 2 H), 4. 6 2-4. 6 7 (m, 1 H), 5. 6 6-5. 9 0 (m, 2 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 3 (s, 1 H), 7. 2 0 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物番号 5-89

δ 1. 5 7-1. 6 9 (m, 2 H), 2. 0 3-2. 0 7 (m, 2 H), 2. 5 9 (br s, 2 H), 3. 1 0 (d, 2 H), 3. 8 9 (s, 3 H), 4. 1 8 (d, 2 H), 4. 6 2 (s, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 1 (s, 1 H), 7. 1 8 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物番号 5-90

δ 1. 4 5 (t, 3 H), 1. 5 7-1. 6 8 (m, 2 H), 2. 0 3-2. 0 7 (m, 2 H), 2. 5 8 (br s, 2 H), 3. 0 8 (d, 2 H), 4. 0 6-4. 2 0 (m, 4 H), 4. 6 2 (s, 1 H), 6. 6 0 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 1 (s, 1 H), 7. 2 0 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物番号 5-176

δ 1. 5 5-1. 6 3 (m, 2 H), 2. 0 2-2. 0 4 (m, 2 H), 2. 5 5-2. 6 2 (m, 4 H), 3. 0 8 (d, 2 H), 4. 0 7 (t, 2 H), 4. 1 5 (dd, 2 H), 4. 6 3 (s, 1 H), 5. 1 6 (dd, 2 H), 5. 8 4-5. 9 7 (m, 1 H), 6. 6 0 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 2 (s, 1 H),

7. 18 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号 5-139

δ 1. 53-1. 63 (m, 2H), 1. 76 (d, 6H), 2. 02-2. 07 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 08 (d, 2H), 4. 16 (dd, 2H), 4. 57 (d, 2H), 4. 62 (s, 1H), 5. 46 (t, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 18 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号 5-123

δ 1. 60-1. 67 (m, 2H), 2. 00-2. 09 (m, 2H), 2. 29 (brs, 1H), 2. 60 (brs, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 94 (brs, 2H), 4. 08-4. 22 (m, 4H), 4. 62 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 19 (s, 1H), 7. 20-7. 30 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号 5-147

δ 1. 58-1. 65 (m, 2H), 2. 04-2. 06 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 10 (d, 2H), 3. 84 (t, 2H), 4. 16-4. 30 (m, 4H), 4. 67 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 24-7. 26 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物番号 5-124

δ 1. 57-1. 69 (m, 2H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 57 (brs, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 43 (s, 3H), 3. 77 (t, 2H), 4. 13-4. 20 (m, 4H), 4. 65 (s, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 17-7. 25 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号 5-132

δ 1.57-1.66 (m, 2H), 2.00-2.06 (m, 2H), 2.59 (br s, 2H), 3.11 (d, 2H), 3.79 (s, 3H), 4.12-4.22 (m, 2H), 4.65-4.69 (m, 3H), 6.60 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.21-7.28 (m, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-134

δ 1.58-1.64 (m, 2H), 1.95-2.13 (m, 2H), 2.06 (s, 3H), 2.58 (br s, 2H), 3.09 (d, 2H), 4.16-4.25 (m, 4H), 4.44 (t, 2H), 4.63 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.22-7.29 (m, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 5-133

δ 1.31 (t, 3H), 1.59-1.65 (m, 2H), 2.04-2.07 (m, 2H), 2.60 (br s, 2H), 3.10 (d, 2H), 4.14-4.30 (m, 4H), 4.68 (s, 3H), 6.61 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.25-7.28 (m, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 5-163

δ 1.15 (t, 3H), 1.62-1.69 (m, 2H), 1.99-2.12 (m, 4H), 2.64 (br s, 2H), 3.14 (d, 2H), 3.32 (t, 2H), 4.23 (dd, 2H), 4.64 (s, 1H), 6.62 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.64 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物 5-126

δ 1.63-1.68 (m, 2H), 1.93-2.04 (m, 2H), 2.35 (s,

3 H), 2. 6 1 (b r s, 2 H), 3. 1 2 (d, 2 H), 4. 2 1 (d d, 2 H),
4. 5 8 (s, 2 H), 4. 6 6 (s, 1 H), 6. 6 2 (d, 1 H), 7. 0 5 (s
- l i k e, 2 H), 7. 2 6 (s - l i k e, 1 H), 7. 6 3 (d d, 1 H),
8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 2 7

δ 1. 2 7 (d, 3 H), 1. 5 9 - 1. 6 7 (m, 2 H), 2. 0 0 - 2. 0 4 (m,
2 H), 2. 6 1 (b r s, 3 H), 3. 1 2 (d, 2 H), 3. 8 1 (t, 1 H),
4. 0 4 (d d, 1 H), 4. 0 8 - 4. 2 2 (m, 3 H), 4. 6 2 (s, 1 H),
6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 3 (d, 1 H), 7. 1 2 (s, 1 H), 7. 2 0 (s
- l i k e, 1 H), 7. 6 3 (d d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 2 8

δ 1. 2 8 (d, 3 H), 1. 5 7 - 1. 6 4 (m, 2 H), 2. 0 1 - 2. 0 4
(m, 2 H), 2. 5 8 (b r s, 2 H), 3. 0 9 (d, 2 H), 3. 4 6 (s,
3 H), 3. 6 9 - 3. 8 0 (m, 1 H), 3. 9 1 - 4. 0 4 (m, 1 H), 4. 1
8 (b r d, 2 H), 4. 6 4 (s, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 1 (d,
1 H), 7. 1 2 (s, 1 H), 7. 1 6 (d, 1 H), 7. 6 2 (d d, 1 H),
8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 2 9

δ 1. 2 8 (s, 6 H), 1. 5 6 - 1. 6 7 (m, 2 H), 1. 9 9 - 2. 0 4
(m, 2 H), 2. 4 6 (s, 1 H), 2. 6 0 (b r s, 2 H), 3. 1 1 (d,
2 H), 3. 8 5 (s, 2 H), 4. 2 0 (d d, 2 H), 4. 6 2 (s, 1 H),
6. 6 2 (d, 1 H), 7. 0 2 (d, 1 H), 7. 1 4 (s, 1 H), 7. 1 8 (s
- l i k e, 1 H), 7. 6 3 (d d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 3 0

δ 1. 3 3 (s, 6 H), 1. 5 8 - 1. 6 4 (m, 2 H), 2. 0 2 - 2. 0 5
(m, 2 H), 2. 5 8 (b r s, 2 H), 3. 1 0 (d, 2 H), 3. 3 1 (s,

3 H), 3. 8 7 (s, 2 H), 4. 1 8 (dd, 2 H), 4. 6 5 (s, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 3 (s, 1 H), 7. 1 8 (d, 1 H); 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 1 4

δ 1. 3 7 (d, 3 H), 1. 5 7 - 1. 6 4 (m, 2 H), 1. 7 7 - 1. 9 0 (m, 1 H), 2. 0 3 - 2. 0 5 (m, 2 H), 2. 0 4 (s, 3 H), 2. 5 7 (brs, 2 H), 3. 0 9 (d, 2 H), 3. 5 7 (t, 1 H), 4. 0 3 - 4. 2 0 (m, 2 H), 4. 6 2 (s, 1 H), 5. 2 5 - 5. 3 5 (m, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 2 (d, 1 H), 7. 1 3 (s, 1 H), 7. 2 2 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 3 8

δ 1. 5 8 - 1. 7 0 (m plus d, 5 H), 2. 0 2 - 2. 0 5 (m, 2 H), 2. 5 8 (brs, 2 H), 3. 1 0 (d, 2 H), 4. 0 3 - 4. 2 1 (m, 4 H), 4. 2 8 - 4. 3 8 (m, 1 H), 4. 6 6 (s, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 4 (d, 1 H), 7. 1 3 (s, 1 H), 7. 1 7 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 9 8

δ 1. 0 6 (t, 3 H), 1. 8 0 - 1. 9 2 (m, 2 H), 2. 0 1 - 2. 0 4 (m, 4 H), 2. 5 7 (brs, 2 H), 2. 9 3 (d, 2 H), 3. 9 7 (t, 2 H), 4. 1 8 (dd, 2 H), 4. 5 7 (s, 1 H), 6. 8 5 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 1 (s, 1 H), 7. 1 7 (d, 1 H), 7. 3 5 (dd, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 2 0 2

δ 1. 4 1 (t, 1 H), 1. 5 9 - 1. 6 6 (m, 2 H), 1. 7 7 (t, 1 H), 2. 0 5 - 2. 2 2 (m, 3 H), 2. 6 0 (brs, 2 H), 3. 1 1 (dd, 2 H), 4. 0 5 (t, 1 H), 4. 1 9 (dd, 2 H), 4. 2 9 (dd, 1 H),

4. 6 6 (s, 1H), 6. 6 1 (d, 1H), 7. 0 5 (d, 1H), 7. 1 4 (s, 1H), 7. 2 3 (d-like, 1H), 7. 6 2 (dd, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物 6 - 8 2

δ 0. 9 2 (t, 3H), 1. 4 2 - 1. 4 7 (m, 1H), 1. 5 7 - 1. 8 0 (m, 5H), 1. 9 8 - 2. 0 4 (m, 2H), 2. 3 5 (brs, 2H), 3. 5 5 (dd, 2H), 3. 9 3 (t, 2H), 4. 0 8 (d, 2H), 4. 4 8 (t, 1H), 6. 6 2 (d, 1H), 6. 9 9 (d, 1H), 7. 0 9 (s, 1H), 7. 1 2 (d, 1H), 7. 6 2 (dd, 1H), 8. 4 2 (s, 1H)

化合物 7 - 1 0 3

δ 0. 3 5 - 0. 4 0 (m, 2H), 0. 6 1 - 0. 6 7 (m, 2H), 1. 2 4 - 1. 3 6 (m, 1H), 1. 4 5 - 1. 5 1 (m, 1H), 1. 5 7 - 1. 6 3 (m, 2H), 1. 6 7 - 1. 8 8 (m, 1H), 2. 1 8 - 2. 3 1 (m, 4H), 3. 2 5 (d, 2H), 3. 9 1 (d, 2H), 4. 4 6 (d, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 6. 6 6 (d, 1H), 7. 0 2 (d, 1H), 7. 1 2 (s, 1H), 7. 1 8 (d, 1H), 7. 6 3 (dd, 1H), 8. 4 2 (s, 1H)

化合物 2 - 1 3 0

δ 1. 3 1 (d, 3H), 2. 0 0 - 2. 2 2 (m, 6H), 2. 4 0 - 2. 5 0 (m, 2H), 3. 4 5 (s, 3H), 3. 7 2 - 3. 8 1 (m, 1H), 3. 8 8 - 3. 9 3 (m, 1H), 4. 0 1 - 4. 0 6 (m, 1H), 4. 5 6 - 4. 6 1 (m+brs, 3H), 6. 5 6 (d, 1H), 6. 7 7 (d, 1H), 7. 1 0 (s, 1H), 7. 1 7 (d, 1H), 7. 6 1 (dd, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

化合物 1 - 9 8

δ 1. 0 5 (t, 3H), 1. 1 3 (d, 3H), 1. 7 1 - 1. 9 1 (m, 4H), 2. 0 5 - 2. 1 5 (m, 2H), 3. 0 0 (dd, 1H), 3. 2 2 - 3. 3 0 (m, 1H), 3. 9 8 (t, 2H), 4. 1 0 - 4. 2 4 (m, 2H), 6. 6 7

(d, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.16 (d, 1H),
7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-118

δ 0.36 (q, 2H), 0.63 (q, 2H), 1.19-1.31 (m, 1H),
1.55-1.63 (m, 2H), 2.07 (br t, 2H), 2.57 (br s,
2H), 3.07 (d, 2H), 3.87 (d, 2H), 4.17 (dd, 2H),
4.63 (s, 1H), 6.59 (d+q, 2H), 6.99-7.03 (m, 3
H), 7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 6-4

δ 1.40-1.56 (m, 1H), 1.75-1.86 (m, 3H), 1.91
-2.05 (m, 2H), 2.61 (br s, 2H), 3.40 (dd, 2H), 4.
16 (d, 2H), 4.56 (t, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.62 (d,
1H), 6.91 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.
63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 2-90

δ 1.08 (t, 3H), 1.81-1.93 (m, 2H), 1.97-2.09
(m, 4H), 2.16-2.24 (m, 2H), 2.40-2.46 (m, 2H),
2.98 (s, 3H), 3.97 (t, 2H), 4.48 (br s, 2H), 4.5
9 (t, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.07 (s, 1
H), 7.14 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 8.07 (s, 1H)

化合物 2-167

δ 0.98 (t, 3H), 1.42 (t, 3H), 1.67-1.75 (m, 2H),
2.01-2.23 (m, 6H), 2.42 (d, 2H), 2.87-2.97 (m,
2H), 4.28-4.35 (m, 2H), 4.57 (br s, 2H), 4.62 (t,
1H), 6.56 (d, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.
62 (dd, 1H), 7.70 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物 1 - 9 5

δ 1. 02 - 1. 16 (m, 8H), 1. 26 (s, 3H), 1. 79 - 1. 94 (m, 4H), 3. 30 (m, 1H), 3. 80 (d, 1H), 3. 90 - 3. 99 (m, 2H), 4. 08 (q, 2H), 4. 13 - 4. 38 (m, 2H), 4. 77 (b r s, 1H), 6. 71 (d, 1H), 7. 06 (s, 1H), 7. 09 (d, 1H), 7. 16 (d, 1H), 7. 60 (dd, 1H), 8. 37 (s, 1H)

化合物 5 - 9 3

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 63 - 1. 69 (m, 2H), 1. 74 - 1. 88 (m, 2H), 2. 00 - 2. 02 (m, 2H), 2. 55 (b r s, 2H), 3. 01 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 07 - 4. 16 (m, 2H), 4. 38 (s, 2H), 4. 59 (s, 1H), 6. 59 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 10 (s, 1H), 7. 13 (d, 1H), 7. 50 (dd, 1H), 8. 12 (s, 1H)

化合物 2 - 8 1

δ 1. 09 (t, 3H), 1. 84 - 2. 21 (m, 8H), 2. 40 - 2. 43 (m, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 56 - 4. 62 (b r m, 3H), 6. 56 (d, 1H), 6. 73 (d, 1H), 7. 08 (s, 1H), 7. 23 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物 2 - 6 7

δ 2. 00 - 2. 21 (m, 4H), 2. 28 - 2. 35 (m, 4H), 4. 59 (b r s, 2H), 4. 66 (t, 1H), 6. 58 (d, 1H), 6. 88 (d, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 7. 74 (d, 1H), 7. 86 (s, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物 5 - 9 9

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 58 - 1. 63 (m, 2H), 1. 65 - 1. 89

(m, 2H), 2.02-2.04 (m, 2H), 2.57 (br s, 2H), 3.06 (d, 2H), 4.00 (t, 2H), 4.16 (d, 2H), 4.62 (s, 1H), 6.57 (t, 1H), 6.63 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.24 (s, 1H)

化合物 5-103

δ 1.04 (t, 3H), 1.57-1.64 (m, 2H), 1.77-1.88 (m, 2H), 1.96-2.04 (m, 2H), 2.58 (br s, 2H), 3.13 (d, 2H), 3.91 (t, 2H), 4.17 (d, 2H), 4.52 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.75 (s-like, 2H), 7.63 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-101

δ 1.06 (t, 3H), 1.47-1.67 (m, 3H), 1.79-1.91 (m, 2H), 2.01-2.04 (m, 2H), 2.56 (br s, 2H), 3.03 (d, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.09 (dd, 2H), 4.57 (br s, 2H), 4.60 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.52 (dd, 1H), 8.14 (s, 1H)

化合物 5-4

δ 1.69 (m, 2H), 1.97 (m, 2H), 2.65 (bs, 2H), 3.14 (d, 2H), 4.24 (dd, 2H), 4.65 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-177

δ 1.62 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 2.53 (s, 1H), 2.60 (bs, 2H), 3.10 (d, 2H), 4.19 (dd, 2H), 4.63 (s,

1 H), 4. 7 7 (s, 2 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 4 (d, 1 H), 7. 2 7 (m, 2 H), 7. 6 2 (d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 7 5

δ 1. 6 3 (m, 2 H), 1. 9 8 (m, 2 H), 2. 6 1 (b s, 2 H), 3. 1 5 (d, 2 H), 3. 3 7 (d, 1 H), 3. 6 8 (d, 1 H), 4. 2 0 (d d, 2 H), 4. 6 1 (s, 1 H), 5. 0 7 (d, 2 H), 5. 9 3 (m, 1 H), 6. 6 3 (d, 1 H), 6. 9 7 (d, 1 H), 7. 4 1 (s, 1 H), 7. 4 5 (d, 1 H), 7. 6 3 (d, 1 H), 8. 4 1 (s, 1 H)

化合物 5 - 6 9

δ 1. 6 5 (m, 2 H), 1. 9 4 (m, 2 H), 2. 6 1 (b s, 2 H), 3. 1 5 (d, 2 H), 3. 4 3 (s, 3 H), 4. 2 1 (d d, 2 H), 4. 6 3 (m, 3 H), 4. 7 7 (s, 2 H), 6. 6 2 (d, 1 H), 7. 0 0 (d, 1 H), 7. 5 3 (d, 1 H), 7. 6 5 (d, 1 H), 7. 7 0 (d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 3 1

δ 1. 3 5 (s, 6 H), 1. 5 8 (m, 2 H), 2. 0 2 (m, 2 H), 2. 5 5 (b s, 2 H), 3. 0 7 (d, 2 H), 3. 6 8 (s, 3 H), 4. 0 2 (s, 2 H), 4. 1 5 (d d, 2 H), 4. 5 8 (s, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 6. 9 9 (d, 1 H), 7. 1 0 (s, 1 H), 7. 1 9 (d, 1 H), 7. 6 2 (d, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 3 7

δ 1. 6 2 (m, 2 H), 2. 0 3 (m, 2 H), 2. 3 6 (s, 6 H), 2. 5 8 (b s, 2 H), 2. 7 7 (t, 2 H), 3. 0 9 (d, 2 H), 4. 1 4 (m, 4 H), 4. 6 3 (s, 1 H), 6. 6 0 (d, 1 H), 7. 0 0 (d, 1 H), 7. 1 4 (s, 1 H), 7. 2 0 (d, 1 H), 7. 6 3 (d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5-136

δ 1.65 (m, 2H), 2.00 (m, 5H), 2.60 (bs, 2H), 3.11 (d, 2H), 3.67 (q, 2H), 4.10 (t, 2H), 4.21 (dd, 2H), 4.62 (s, 1H), 5.94 (bs, 1H), 6.62 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-73

δ 1.41 (d, 3H), 1.65 (d, 2H), 1.97 (m, 2H), 2.62 (bs, 1H), 3.15 (d, 2H), 3.37 (s, 3H), 4.20 (m, 2H), 4.62 (m, 3H), 5.08 (q, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-229

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.22 (t, 3H), 1.40 (d, 3H), 1.60-1.66 (m, 2H), 1.95-1.99 (m, 2H), 2.61 (bs, 2H), 3.14 (d, 2H), 3.49-3.59 (m, 1H), 3.63-3.73 (m, 1H), 4.22 (dd, 2H), 4.50-4.66 (m, 3H), 4.86 (q, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.40

化合物 9-94

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.09 (t, 3H), 1.63-1.75 (m, 2H), 1.84-1.95 (m, 2H), 2.04-2.10 (m, 2H), 3.19-3.28 (m, 2H), 3.54-3.62 (m, 1H), 4.03 (t, 2H), 4.21-4.28 (m, 2H), 6.64 (d, 1H), 7.04 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.38 (s, 1H)

化合物 11-93

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.08 (t, 3H), 1.79-1.95 (m, 8H), 2.10-2.17 (m, 2H), 3.85-3.96 (m, 1H), 4.01 (t, 2H), 4.61 (brs, 2H), 6.52 (d, 1H), 7.01 (s, 1H), 7.12 (dd, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-246

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.63-1.68 (m, 2H), 1.96-2.03 (m, 2H), 2.62 (brs, 2H), 2.90 (t, 2H), 3.15 (d, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.57 (t, 2H), 4.22 (dd, 2H), 4.60 (s, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-247 (trans/cis=59/41)

trans 体

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.56-1.68 (m, 2H), 1.98-2.06 (m, 2H), 2.62 (brs, 2H), 3.13 (d, 2H), 3.70 (s, 3H), 4.20 (d, 2H), 4.63 (s, 1H), 5.95 (d, 1H), 6.61 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.64 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

cis 体

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.56-1.68 (m, 2H), 1.98-2.06 (m, 2H), 2.62 (brs, 2H), 3.13 (d, 2H), 3.81 (s, 3H), 4.20 (d, 2H), 4.60 (s, 1H), 5.56 (d, 1H), 6.23 (d, 1H), 6.61 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.64 (dd, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 2-203

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.36 (t, 3H), 1.99-2.35 (m, 8H), 4.27 (q, 2H), 4.59 (brs, 2H), 4.65 (t, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.76 (d, 1H), 7.54 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.43 (s, 1H)

化合物 2-224

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.36 (t, 3H), 1.83 (s, 3H), 1.92-2.07 (m, 4H), 2.15-2.29 (m, 4H), 4.26 (q, 2H), 4.53 (brs, 2H), 4.60 (t, 1H), 6.54 (d, 1H), 6.76 (d, 1H), 7.04 (s, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 2-148

δ 2.00-2.23 (m, 6H), 2.35-2.44 (m, 2H), 4.56-4.61 (m, 4H), 4.82 (q, 1H), 6.06-6.64 (m, 2H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 2-144

δ 1.99-2.20 (m, 6H), 2.40-2.47 (m, 2H), 2.57-2.64 (m, 2H), 4.07 (t, 2H), 4.55-4.60 (m, 3H), 5.14 (dd, 2H), 5.86-5.99 (m, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 2-115

δ 2.00-2.30 (m, 7H), 2.35-2.44 (m, 2H), 3.97-4.03 (m, 2H), 4.16 (t, 2H), 4.52-4.65 (brs p

1 u s t, 3 H), 6. 5 6 (d, 1 H), 6. 7 8 (d, 1 H), 7. 1 4 (s, 1 H), 7. 1 9 (d, 1 H), 7. 6 2 (d d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 2 - 1 5 3

δ 1. 0 5 (t, 3 H), 1. 7 6 - 1. 8 4 (m, 2 H), 2. 0 3 (d, 2 H), 2. 1 7 - 2. 2 0 (m, 2 H), 2. 3 6 - 2. 4 0 (m, 4 H), 3. 3 6 (t, 2 H), 4. 6 1 (b r s, 2 H), 4. 7 2 (t, 1 H), 6. 5 8 (d, 1 H), 6. 9 2 (d, 1 H), 7. 6 4 (d, 1 H), 7. 8 0 (d, 1 H), 8. 2 8 (s, 1 H), 8. 4 2 (s, 1 H)

化合物 2 - 1 1 2

δ 2. 0 0 - 2. 2 1 (m, 6 H), 2. 3 9 - 2. 4 7 (m, 2 H), 3. 4 4 (s, 3 H), 3. 7 9 (t, 2 H), 4. 1 6 (t, 2 H), 4. 5 6 (b r s, 2 H), 4. 6 2 (b r s, 1 H), 6. 5 5 (d, 1 H), 6. 7 8 (d, 1 H), 7. 1 2 (s, 1 H), 7. 1 8 (d, 1 H), 7. 6 1 (d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 2 - 1 6 1

δ 0. 8 9 (t, 3 H), 1. 4 7 - 1. 6 3 (m, 2 H), 2. 0 7 - 2. 1 1 (m, 4 H), 2. 1 9 - 2. 2 7 (m, 2 H), 2. 3 8 - 2. 4 5 (m, 2 H), 2. 8 0 (s, 3 H), 3. 0 8 (t, 2 H), 4. 5 6 (b r s, 2 H), 4. 6 0 (t, 1 H), 6. 5 6 (d, 1 H), 6. 7 2 (d, 1 H), 7. 1 5 (s, 1 H), 7. 1 7 (d, 1 H), 7. 6 0 (d d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 2 - 1 4 3

δ 2. 0 0 - 2. 2 4 (m, 6 H), 2. 3 8 - 2. 4 5 (m, 2 H), 2. 5 4 - 2. 5 6 (m, 1 H), 4. 5 6 - 4. 6 3 (b r s p l u s t, 3 H), 4. 7 7 (d, 2 H), 6. 5 6 (d, 1 H), 6. 7 9 (d, 1 H), 7. 2 2 (s, 1 H), 7. 2 5 (d, 1 H), 7. 6 1 (d d, 1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 2-138

δ 2.05-2.26 (m, 6H), 2.41-2.48 (m, 2H), 3.87 (t, 2H), 4.31 (t, 2H), 4.61-4.64 (brs plus t, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 2-101

δ 2.11-2.40 (m, 8H), 4.58 (brs, 2H), 4.65 (t, 1H), 4.86 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物 5-175

δ 1.57-1.64 (m, 2H), 1.75 (d, 3H), 2.03-2.06 (m, 2H), 2.58 (brs, 2H), 3.08 (d, 2H), 4.18 (dd, 2H), 4.51 (d, 2H), 4.62-4.67 (m, 1H), 5.66-5.90 (m, 2H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-89

δ 1.57-1.69 (m, 2H), 2.03-2.07 (m, 2H), 2.59 (brs, 2H), 3.10 (d, 2H), 3.89 (s, 3H), 4.18 (d, 2H), 4.62 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-90

δ 1.45 (t, 3H), 1.57-1.68 (m, 2H), 2.03-2.07 (m, 2H), 2.58 (brs, 2H), 3.08 (d, 2H), 4.06-4.20 (m, 4H), 4.62 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.01 (d,

1 H), 7. 1 1 (s, 1 H), 7. 2 0 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H),
8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 7 6

δ 1. 5 5 - 1. 6 3 (m, 2 H), 2. 0 2 - 2. 0 4 (m, 2 H), 2. 5 5
- 2. 6 2 (m, 4 H), 3. 0 8 (d, 2 H), 4. 0 7 (t, 2 H), 4. 1 5
(dd, 2 H), 4. 6 3 (s, 1 H), 5. 1 6 (dd, 2 H), 5. 8 4 - 5.
9 7 (m, 1 H), 6. 6 0 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 2 (s,
1 H), 7. 1 8 (d, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 3 9

δ 1. 5 3 - 1. 6 3 (m, 2 H), 1. 7 6 (d, 6 H), 2. 0 2 - 2. 0 7
(m, 2 H), 2. 5 8 (brs, 2 H), 3. 0 8 (d, 2 H), 4. 1 6 (dd,
2 H), 4. 5 7 (d, 2 H), 4. 6 2 (s, 1 H), 5. 4 6 (t, 1 H), 6.
6 0 (d, 1 H), 7. 0 1 (d, 1 H), 7. 1 3 (s, 1 H), 7. 1 8 (d,
1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 2 3

δ 1. 6 0 - 1. 6 7 (m, 2 H), 2. 0 0 - 2. 0 9 (m, 2 H), 2. 2 9
(brs, 1 H), 2. 6 0 (brs, 2 H), 3. 1 1 (d, 2 H), 3. 9 4 (b
rs, 2 H), 4. 0 8 - 4. 2 2 (m, 4 H), 4. 6 2 (s, 1 H), 6. 6 1
(d, 1 H), 7. 0 4 (d, 1 H), 7. 1 9 (s, 1 H), 7. 2 0 - 7. 3 0
(m, 1 H), 7. 6 2 (dd, 1 H), 8. 3 9 (s, 1 H)

化合物 5 - 1 4 7

δ 1. 5 8 - 1. 6 5 (m, 2 H), 2. 0 4 - 2. 0 6 (m, 2 H), 2. 5 8
(brs, 2 H), 3. 1 0 (d, 2 H), 3. 8 4 (t, 2 H), 4. 1 6 - 4.
3 0 (m, 4 H), 4. 6 7 (s, 1 H), 6. 6 1 (d, 1 H), 7. 0 5 (d,
1 H), 7. 1 6 (s, 1 H), 7. 2 4 - 7. 2 6 (m, 1 H), 7. 6 2 (dd,
1 H), 8. 4 0 (s, 1 H)

化合物 5-124

δ 1. 57-1. 69 (m, 2H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 57 (b r s, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 43 (s, 3H), 3. 77 (t, 2H), 4. 13-4. 20 (m, 4H), 4. 65 (s, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 17-7. 25 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物 5-132

δ 1. 57-1. 66 (m, 2H), 2. 00-2. 06 (m, 2H), 2. 59 (b r s, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 79 (s, 3H), 4. 12-4. 22 (m, 2H), 4. 65-4. 69 (m, 3H), 6. 60 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 21-7. 28 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物 5-134

δ 1. 58-1. 64 (m, 2H), 1. 95-2. 13 (m, 2H), 2. 06 (s, 3H), 2. 58 (b r s, 2H), 3. 09 (d, 2H), 4. 16-4. 25 (m, 4H), 4. 44 (t, 2H), 4. 63 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 22-7. 29 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物 5-133

δ 1. 31 (t, 3H), 1. 59-1. 65 (m, 2H), 2. 04-2. 07 (m, 2H), 2. 60 (b r s, 2H), 3. 10 (d, 2H), 4. 14-4. 30 (m, 4H), 4. 68 (s, 3H), 6. 61 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 25-7. 28 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物 5-203

δ 1. 57-1. 64 (m, 2H), 2. 01-2. 09 (m, 2H), 2. 57 (b r s, 2H), 3. 10 (d, 2H), 3. 93-4. 21 (m, 8H), 4. 64 (s, 1H), 5. 32 (t, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 17 (s, 1H), 7. 21-7. 26 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物 5-163

δ 1. 15 (t, 3H), 1. 62-1. 69 (m, 2H), 1. 99-2. 12 (m, 4H), 2. 64 (b r s, 2H), 3. 14 (d, 2H), 3. 32 (t, 2H), 4. 23 (d d, 2H), 4. 64 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 14 (d, 1H), 7. 53 (d, 1H), 7. 54 (s, 1H), 7. 64 (d d, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物 5-204

δ 1. 59-1. 70 (m, 2H), 1. 85-2. 09 (m, 6H), 2. 57, 2. 64 (two s, total 2H), 3. 12 (t-like, 2H), 3. 82 (q, 1H), 3. 93 (q, 1H), 4. 02 (d, 2H), 4. 11-4. 30 (m, 3H), 4. 64 (s, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 14 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-126

δ 1. 63-1. 68 (m, 2H), 1. 93-2. 04 (m, 2H), 2. 35 (s, 3H), 2. 61 (b r s, 2H), 3. 12 (d, 2H), 4. 21 (d d, 2H), 4. 58 (s, 2H), 4. 66 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 05 (s-like, 2H), 7. 26 (s-like, 1H), 7. 63 (d d, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物 5-127

δ 1. 27 (d, 3H), 1. 59-1. 67 (m, 2H), 2. 00-2. 04

(m, 2H), 2.61 (brs, 3H), 3.12 (d, 2H), 3.81 (t, 1H), 4.04 (dd, 1H), 4.08-4.22 (m, 3H), 4.62 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.20 (s-like, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-128

δ 1.28 (d, 3H), 1.57-1.64 (m, 2H), 2.01-2.04 (m, 2H), 2.58 (brs, 2H), 3.09 (d, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.69-3.80 (m, 1H), 3.91-4.04 (m, 1H), 4.18 (brd, 2H), 4.64 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-129

δ 1.28 (s, 6H), 1.56-1.67 (m, 2H), 1.99-2.04 (m, 2H), 2.46 (s, 1H), 2.60 (brs, 2H), 3.11 (d, 2H), 3.85 (s, 2H), 4.20 (dd, 2H), 4.62 (s, 1H), 6.62 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.18 (s-like, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-130

δ 1.33 (s, 6H), 1.58-1.64 (m, 2H), 2.02-2.05 (m, 2H), 2.58 (brs, 2H), 3.10 (d, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.87 (s, 2H), 4.18 (dd, 2H), 4.65 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-114

δ 1.37 (d, 3H), 1.57-1.64 (m, 2H), 1.77-1.90 (m, 1H), 2.03-2.05 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.57

(b r s, 2H), 3. 0 9 (d, 2H), 3. 5 7 (t, 1H), 4. 0 3-4. 2 0 (m, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 5. 2 5-5. 3 5 (m, 1H), 6. 6 1 (d, 1H), 7. 0 2 (d, 1H), 7. 1 3 (s, 1H), 7. 2 2 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物 5-138

δ 1. 5 8-1. 7 0 (m p l u s d, 5H), 2. 0 2-2. 0 5 (m, 2H), 2. 5 8 (b r s, 2H), 3. 1 0 (d, 2H), 4. 0 3-4. 2 1 (m, 4H), 4. 2 8-4. 3 8 (m, 1H), 4. 6 6 (s, 1H), 6. 6 1 (d, 1H), 7. 0 4 (d, 1H), 7. 1 3 (s, 1H), 7. 1 7 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

化合物 5-206

δ 1. 5 8-1. 6 3 (m, 2H), 2. 0 0-2. 0 4 (m, 2H), 2. 5 6 (b r s, 2H), 3. 0 6 (d, 2H), 4. 1 7 (d d, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 5. 0 5 (s, 2H), 6. 3 4-6. 4 1 (m, 2H); 6. 6 0 (d, 1H), 7. 0 2 (d, 1H), 7. 2 2 (s-l i k e, 2H), 7. 4 3 (s, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物 5-208

δ 1. 5 7-1. 6 4 (m, 2H), 2. 0 0-2. 0 4 (m, 2H), 2. 5 8 (b r s, 2H), 3. 0 6 (d, 2H), 4. 1 7 (d d, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 5. 1 2 (s, 2H), 6. 6 1 (d, 1H), 7. 0 3 (d, 1H), 7. 1 4 (d, 1H), 7. 2 0-7. 2 1 (m, 2H), 7. 3 1-7. 3 5 (m, 2H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物 5-207

δ 1. 5 7-1. 6 4 (m, 2H), 2. 0 0-2. 0 3 (m, 2H), 2. 5 7 (b r s, 2H), 3. 0 7 (d, 2H), 4. 1 8 (d d, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 5. 0 0 (s, 2H), 6. 4 7 (s, 1H), 6. 6 0 (d, 1H), 7.

0.3 (d, 1H), 7.21 (d-like, 2H), 7.43 (s, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-98

δ 1.06 (t, 3H), 1.80-1.92 (m, 2H), 2.01-2.04 (m, 4H), 2.57 (brs, 2H), 2.93 (d, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.18 (dd, 2H), 4.57 (s, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.35 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-209

δ 1.57-1.63 (m, 2H), 2.04-2.06 (m, 2H), 2.58 (brs, 2H), 3.07 (d, 2H), 4.17 (dd, 2H), 4.64 (s, 1H), 5.27 (s, 2H), 6.60 (d, 1H), 6.98-7.09 (m, 3H), 7.24 (d-like, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-104

δ 1.41 (t, 1H), 1.59-1.66 (m, 2H), 1.77 (t, 1H), 2.05-2.22 (m, 3H), 2.60 (brs, 2H), 3.11 (dd, 2H), 4.05 (t, 1H), 4.19 (dd, 2H), 4.29 (dd, 1H), 4.66 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.23 (d-like, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-206

δ 0.92 (t, 3H), 1.42-1.47 (m, 1H), 1.57-1.80 (m, 5H), 1.98-2.04 (m, 2H), 2.35 (brs, 2H), 3.55 (dd, 2H), 3.93 (t, 2H), 4.08 (d, 2H), 4.48 (t, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.

1 2 (d, 1H), 7. 6 2 (d d, 1H), 8. 4 2 (s, 1H)

化合物 7 - 1 0 3

δ 0. 3 5 - 0. 4 0 (m, 2H), 0. 6 1 - 0. 6 7 (m, 2H), 1. 2 4 - 1. 3 6 (m, 1H), 1. 4 5 - 1. 5 1 (m, 1H), 1. 5 7 - 1. 6 3 (m, 2H), 1. 6 7 - 1. 8 8 (m, 1H), 2. 1 8 - 2. 3 1 (m, 4H), 3. 2 5 (d, 2H), 3. 9 1 (d, 2H), 4. 4 6 (d, 2H), 4. 6 2 (s, 1H), 6. 6 6 (d, 1H), 7. 0 2 (d, 1H), 7. 1 2 (s, 1H), 7. 1 8 (d, 1H), 7. 6 3 (d d, 1H), 8. 4 2 (s, 1H)

化合物 2 - 1 3 0

δ 1. 3 1 (d, 3H), 2. 0 0 - 2. 2 2 (m, 6H), 2. 4 0 - 2. 5 0 (m, 2H), 3. 4 5 (s, 3H), 3. 7 2 - 3. 8 1 (m, 1H), 3. 8 8 - 3. 9 3 (m, 1H), 4. 0 1 - 4. 0 6 (m, 1H), 4. 5 6 - 4. 6 1 (m + b r s, 3H), 6. 5 6 (d, 1H), 6. 7 7 (d, 1H), 7. 1 0 (s, 1H), 7. 1 7 (d, 1H), 7. 6 1 (d d, 1H), 8. 4 0 (s, 1H)

化合物 1 - 9 8

δ 1. 0 5 (t, 3H), 1. 1 3 (d, 3H), 1. 7 1 - 1. 9 1 (m, 4H), 2. 0 5 - 2. 1 5 (m, 2H), 3. 0 0 (d d, 1H), 3. 2 2 - 3. 3 0 (m, 1H), 3. 9 8 (t, 2H), 4. 1 0 - 4. 2 4 (m, 2H), 6. 6 7 (d, 1H), 6. 9 8 (d, 1H), 7. 1 0 (d, 1H), 7. 1 6 (d, 1H), 7. 6 1 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物 5 - 1 1 8

δ 0. 3 6 (q, 2H), 0. 6 3 (q, 2H), 1. 1 9 - 1. 3 1 (m, 1H), 1. 5 5 - 1. 6 3 (m, 2H), 2. 0 7 (b r t, 2H), 2. 5 7 (b r s, 2H), 3. 0 7 (d, 2H), 3. 8 7 (d, 2H), 4. 1 7 (d d, 2H), 4. 6 3 (s, 1H), 6. 5 9 (d + q, 2H), 6. 9 9 - 7. 0 3 (m, 3H), 7. 6 1 (d d, 1H), 8. 3 9 (s, 1H)

化合物 8-4

δ 1.40-1.56 (m, 1H), 1.75-1.86 (m, 3H), 1.91-2.05 (m, 2H), 2.61 (br s, 2H), 3.40 (dd, 2H), 4.16 (d, 2H), 4.56 (t, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 2-90

δ 1.08 (t, 3H), 1.81-1.93 (m, 2H), 1.97-2.09 (m, 4H), 2.16-2.24 (m, 2H), 2.40-2.46 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 3.97 (t, 2H), 4.48 (br s, 2H), 4.59 (t, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 8.07 (s, 1H)

化合物 2-167

δ 0.98 (t, 3H), 1.42 (t, 3H), 1.67-1.75 (m, 2H), 2.01-2.23 (m, 6H), 2.42 (d, 2H), 2.87-2.97 (m, 2H), 4.28-4.35 (m, 2H), 4.57 (br s, 2H), 4.62 (t, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.70 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物 1-95

δ 1.02-1.16 (m, 8H), 1.26 (s, 3H), 1.79-1.94 (m, 4H), 3.30 (m, 1H), 3.80 (d, 1H), 3.90-3.99 (m, 2H), 4.08 (q, 2H), 4.13-4.38 (m, 2H), 4.77 (br s, 1H), 6.71 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

化合物 5-93

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 63-1. 69 (m, 2H), 1. 74-1. 88 (m, 2H), 2. 00-2. 02 (m, 2H), 2. 55 (b r s, 2H), 3. 01 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 07-4. 16 (m, 2H), 4. 38 (s, 2H), 4. 59 (s, 1H), 6. 59 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 10 (s, 1H), 7. 13 (d, 1H), 7. 50 (d d, 1H), 8. 12 (s, 1H)

化合物 2-81

δ 1. 09 (t, 3H), 1. 84-2. 21 (m, 8H), 2. 40-2. 43 (m, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 56-4. 62 (b r m, 3H), 6. 56 (d, 1H), 6. 73 (d, 1H), 7. 08 (s, 1H), 7. 23 (m, 1H), 7. 62 (d d, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物 2-67

δ 2. 00-2. 21 (m, 4H), 2. 28-2. 35 (m, 4H), 4. 59 (b r s, 2H), 4. 66 (t, 1H), 6. 58 (d, 1H), 6. 88 (d, 1H), 7. 63 (d d, 1H), 7. 74 (d, 1H), 7. 86 (s, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物 5-99

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 58-1. 63 (m, 2H), 1. 65-1. 89 (m, 2H), 2. 02-2. 04 (m, 2H), 2. 57 (b r s, 2H), 3. 06 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 16 (d, 2H), 4. 62 (s, 1H), 6. 57 (t, 1H), 6. 63 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 60 (d d, 1H), 8. 24 (s, 1H)

化合物 5-103

δ 1. 04 (t, 3H), 1. 57-1. 64 (m, 2H), 1. 77-1. 88 (m, 2H), 1. 96-2. 04 (m, 2H), 2. 58 (b r s, 2H), 3.

1.3 (d, 2H), 3.91 (t, 2H), 4.17 (d, 2H), 4.52 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.75 (s-like, 2H), 7.63 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 5-101

δ 1.06 (t, 3H), 1.47-1.67 (m, 3H), 1.79-1.91 (m, 2H), 2.01-2.04 (m, 2H), 2.56 (brs, 2H), 3.03 (d, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.09 (dd, 2H), 4.57 (brs, 2H), 4.60 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.52 (dd, 1H), 8.14 (s, 1H)

製剤実施例

[殺虫・殺ダニ剤]

次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

製剤実施例 1 水和剤

本発明化合物	40部
珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

以上を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分40%の水和剤を得た。

製剤実施例 2 乳剤

本発明化合物	30部
キシレン	33部
ジメチルホルムアミド	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	7部

以上を混合溶解して、有効成分 30 % の乳剤を得た。

製剤実施例 3 粉剤

本発明化合物	10部
タルク	89部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	1部

以上を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分 10 % の粉剤を得た。

製剤実施例 4 粒剤

本発明化合物	5部
クレー	73部
ベントナイト	20部
ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩	1部
リン酸ナトリウム	1部

以上をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分 5 % の粒剤を得た。

製剤実施例 5 懸濁剤

本発明化合物	10部
リグニンスルホン酸ナトリウム	4部
ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム	1部
キサントガム	0.2部
水	84.8部

以上を混合し、粒度が 1 ミクロン以下になるまで湿式粉碎し、有効成分 10 % の懸濁液を得た。

次に、本発明化合物が各種殺ダニ剤の有効成分として有用であることを試験例で示す。

試験例 1 ナミハダニに対する効力

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ～ 10 日を経過した第 1 本葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を 17 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 1 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 125 ppm になるように水で希釈した薬液を散布した。温度 25℃、湿度 65% の恒温室内に置き、3 日後に殺成虫率を調査した。試験は 2 反復である。その結果以下の化合物が 100% の殺虫率を示した。

1-8、1-9、1-10、1-13、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-22、1-23、1-27、1-29、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-54、1-57、1-59、1-63、1-66、1-67、1-69、1-71、1-72、1-73、1-74、1-75、1-76、1-79、1-80、1-81、1-82、1-88、1-89、1-90、1-91、1-92、1-93、1-94、1-97、1-98、1-100、1-101、1-102、1-105、1-108、1-114、1-115、1-117、1-118、1-133、1-136、1-139、1-140、1-142、1-143、1-147、1-150、1-153、1-163、1-172、1-173、1-174、1-179、1-180、1-181、1-182、1-183、1-184、1-186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、1-192、2-51、2-54、2-57、2-58、2-59、2-60、2-62、2-77、2-78、2-81、2-82、2-83、2-84、2-85、2-86、2-89、2-93、2-95、2-96、2-97、2-98、2-100、2-102、2-105、2-111、2-112、2-115、2-130、2-138、2-141、2-143、2-144、2-145、2-147、2-148、2-150、2-151、2-152、2-155、2-157、2-159、2-160、2-161、2-165、2-166、2-168、2-169、2-171、2-173、2-174、2-175、2-177、2-178、2-179、2-181、2-182、2-183、2-184、2-186、2-187、2-190、2-192、2-193、2-194、2-195、2-196、2-198、2-199、2-200、2-201、2-203、2-205、2-208、2-209、2-210、2-

2 1 1、2 - 2 1 2、2 - 2 1 3、2 - 2 2 0、2 - 2 2 1、2 - 2 2 3、2 -
2 2 5、2 - 2 2 6、2 - 2 2 7、2 - 2 3 0、2 - 2 3 2、2 - 2 3 3、2 -
2 3 4、2 - 2 3 5、2 - 2 3 6、2 - 2 3 7、2 - 2 3 9、2 - 2 4 0、2 -
2 4 5、2 - 2 4 6、2 - 2 4 7、2 - 2 4 8、2 - 2 4 9、2 - 2 5 0
5 - 2 2、5 - 3 2、5 - 3 8、5 - 6 9、5 - 7 0、5 - 7 2、5 - 7 3、5
- 7 5、5 - 8 9、5 - 9 0、5 - 9 6、5 - 9 7、5 - 9 8、5 - 9 9、5 -
1 0 0、5 - 1 0 2、5 - 1 0 4、5 - 1 0 5、5 - 1 0 6、5 - 1 1 0、5 -
1 1 1、5 - 1 1 4、5 - 1 1 6、5 - 1 1 8、5 - 1 2 0、5 - 1 2 1、5 -
1 2 4、5 - 1 2 5、5 - 1 2 6、5 - 1 2 7、5 - 1 2 8、5 - 1 2 9、5 -
1 3 0、5 - 1 3 4、5 - 1 3 8、5 - 1 3 9、5 - 1 4 7、5 - 1 4 9、5 -
1 6 1、5 - 1 6 2、5 - 1 6 3、5 - 1 6 4、5 - 1 7 4、5 - 1 7 5、5 -
1 7 6、5 - 1 7 7、5 - 1 8 2、5 - 1 8 3、5 - 1 8 4、5 - 1 9 0、5 -
1 9 1、5 - 1 9 8、5 - 1 9 9、5 - 2 0 0、5 - 2 0 3、5 - 2 0 4、5 -
2 0 5、5 - 2 0 6、5 - 2 0 7、5 - 2 0 8、5 - 2 0 9、5 - 2 1 0、5 -
2 1 1、5 - 2 1 2、5 - 2 1 3、5 - 2 1 4、5 - 2 1 5、5 - 2 1 7、5 -
2 1 8、5 - 2 2 0、5 - 2 2 2、5 - 2 2 3、5 - 2 2 4、5 - 2 2 5、5 -
2 2 7、5 - 2 2 9、5 - 2 3 0、5 - 2 3 1、5 - 2 3 2、5 - 2 3 3、5 -
2 3 4、5 - 2 3 5、5 - 2 3 6、5 - 2 3 7、5 - 2 3 8、5 - 2 3 9、5 -
2 4 0、5 - 2 4 2、5 - 2 4 3、5 - 2 4 4、5 - 2 4 5、5 - 2 4 6、5 -
2 4 7、5 - 2 4 9、5 - 2 5 5、5 - 2 5 6、5 - 2 5 7、5 - 2 5 8、5 -
2 5 9、5 - 2 6 0、5 - 2 6 1、5 - 2 6 2、5 - 2 6 3、5 - 2 6 4
7 - 8 2、7 - 1 0 0、7 - 1 0 3
8 - 6 3

試験例 2 ミカンハダニに対する効力

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニの雌成虫を 10
頭接種したのち、前記薬剤の実施例 2 に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度
が 3 1 p p m になるように水で希釈した薬液を回転散布塔にて散布した。温度 2
5℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、散布 3 日後に、成虫を除去し、この 3 日間
に産付された卵に関し、成虫まで発育し得たか否かを 1 1 日目に調査した。その

結果以下の化合物が100%の殺虫率を示した。

1-13、1-15、1-22、1-27、1-45、1-54、1-59、1-63、1-66、1-69、1-71、1-72、1-75、1-80、1-88、1-89、1-92、1-93、1-94、1-97、1-98、1-100、1-102、1-105、1-108、1-133、1-136、1-142、1-153、1-181、1-183、1-186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191
2-54、2-57、2-58、2-59、2-60、2-78、2-81、2-82、2-84、2-97、2-98、2-105、2-130、2-141、2-147、2-177、2-181、2-183、2-193、2-196、2-208、2-209、2-210、2-212、2-247、2-249
5-22、5-69、5-72、5-73、5-90、5-97、5-105、5-110、5-111、5-116、5-118、5-120、5-121、5-124、5-149、5-162、5-174、5-175、5-177、5-190、5-203、5-215、5-217、5-218、5-220、5-222、5-224、5-225、5-227、5-229、5-230、5-233、5-234、5-236、5-237、5-239、5-243、5-245、5-256、5-257、5-259、5-260、5-261、5-262
7-82、7-100、7-103

試験例3 アワヨトウに対する効力

市販の人工飼料（インセクタLFS，日本農産工業製）0.2mlをプラスチック製試験チューブ（1.4ml容）に詰めて試験用飼料とした。薬剤は、DMSO（0.5% tween 20を含む）を用い1%化合物溶液を調整し、飼料表面に化合物10 μ g 相当量を滴下処理した。アワヨトウ2齢幼虫を各試験チューブ当り2頭接種し、プラスチック製の蓋で密閉した。25℃に放置し、5日後に殺虫率と摂食量を調べた。試験は2反復で行った。本試験において以下の化合物が殺虫率が100%、または摂食量が対溶媒対照区比10%以下となり有効であった。

1-8、1-9、1-13、1-15、1-17、1-22、1-23、1-27、1-39、1-45、1-46、1-59、1-69、1-72、1-74、1-75、1-79、1-80、1-83、1-95、1-97、1-98、1-100、1-105、1-108、1-114、1-133、1-140、1-147、1-153、1-165、1-166、1-181、1-182、1-183、1-184、1-187、1-189、1-190

2-21、2-30、2-51、2-54、2-57、2-67、2-82、2-83、2-94、2-130、2-138、2-141、2-143、2-144、2-148、2-160、2-161、2-162、2-166、2-167、2-169、2-170、2-171、2-176、2-177、2-181、2-182、2-185、2-193、2-203、2-204、2-208、2-211、2-213、2-226、2-233、2-235、2-236、2-237、2-238、2-239、2-240、2-246

3-62、3-131

5-22、5-73、5-75、5-89、5-90、5-96、5-97、5-105、5-110、5-116、5-120、5-138、5-147、5-149、5-147、5-149、5-174、5-175、5-176、5-190、5-210、5-212、5-224、5-225、5-228、5-237、5-241、5-242、5-243、5-244、5-245、5-246、5-256、5-259、5-262、5-265

6-82

7-82、7-103

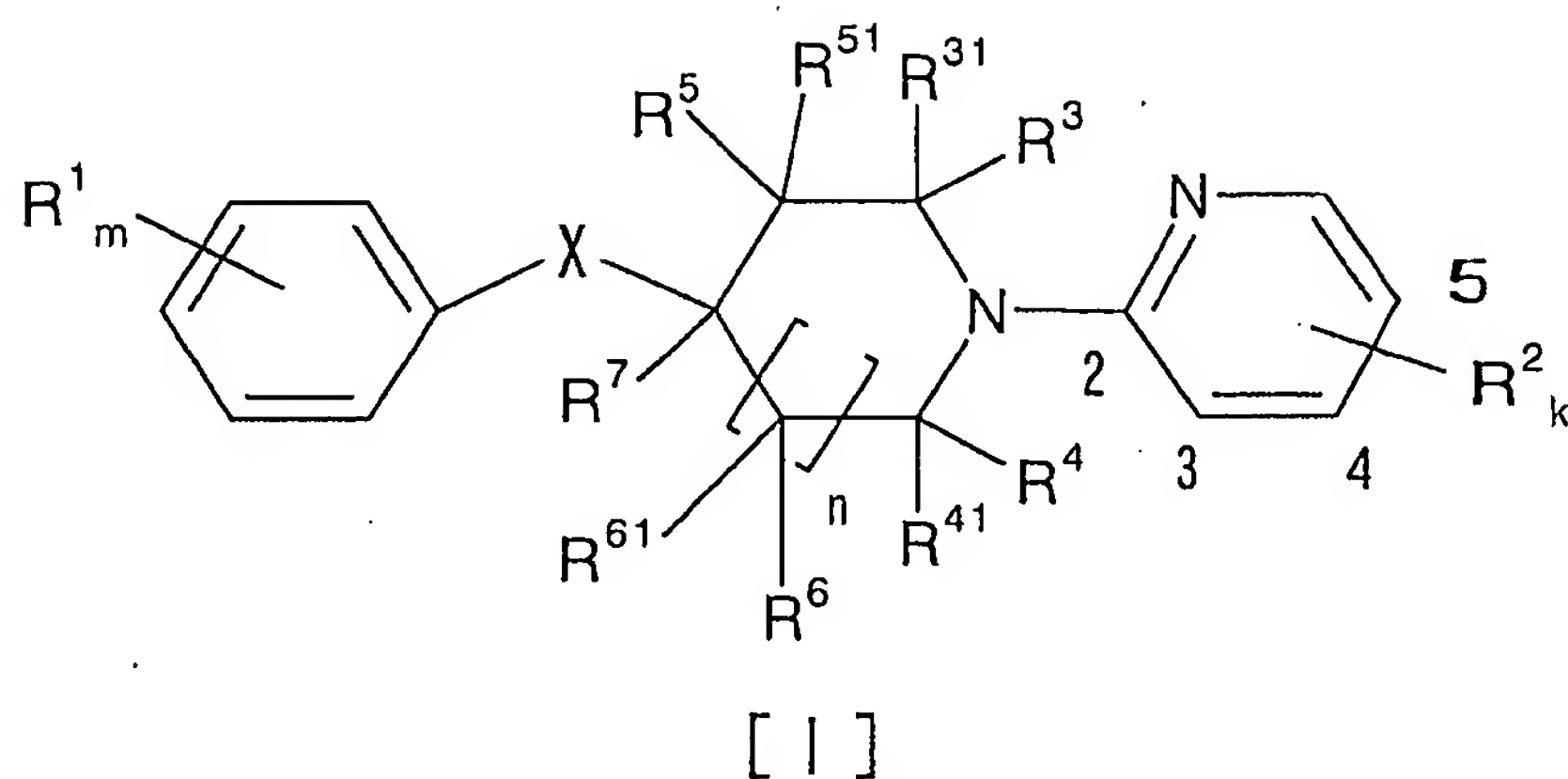
9-83、9-94

産業上の利用可能性

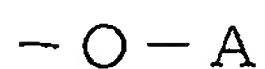
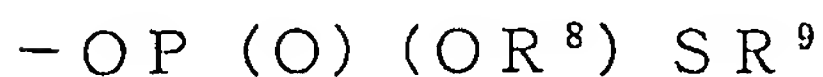
式〔I〕で示された環状アミン化合物、その塩またはその酸化物は、殺虫、殺ダニ剤の有効成分として優れた効果を示す。

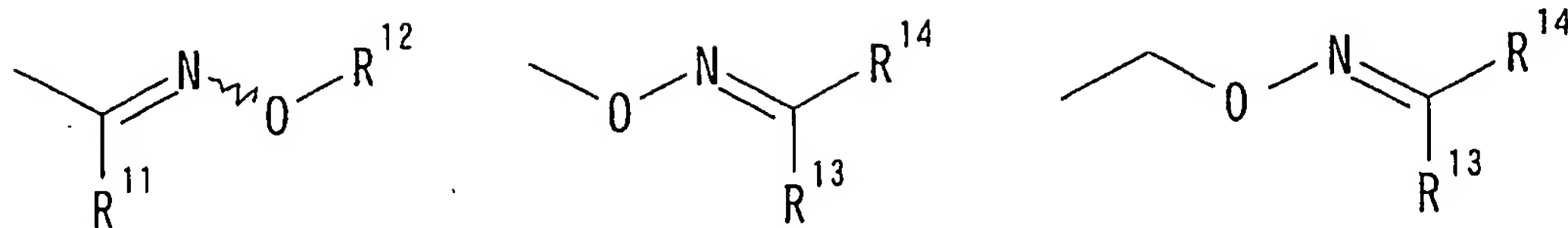
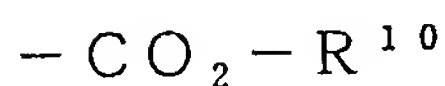
請求の範囲

1. 式[I]



[式中、 R^1 は、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、 G^1 で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{1-6} ハロアルケニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 G^2 で置換されてもよい C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} ハロアルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルチオカルボニルオキシ基、 G^3 で置換されてもよいアミノ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} ハロアルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニルオキシ基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニルオキシ基、 G^4 で置換されてもよい（酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の）複素環基、または下記式





[式中、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立して C_{1-6} アルキル基を示し、 Y^1 、 Y^2 および Y^3 はそれぞれ独立して酸素原子または硫黄原子を示し、 A は G^4 で置換されてもよい（酸素原子および窒素原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の）複素環基を示し、 R^{10} は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{1-6} アルキル C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、または G^4 で置換されてもよい（酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の）複素環基を示し、 R^{11} および R^{12} はそれぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、または C_{2-6} アルキニル基を示し、 R^{13} および R^{14} はそれぞれ独立して C_{1-6} アルキル基を示し、 R^{13} および R^{14} は結合して環を形成してもよい。]

で表される置換基のいずれかを示し、 m は0または1～5の整数を示す。

R^2 は、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 G^4 で置換されてもよい（酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の複素環基）、または C_{1-6} ハロアルコキシ基を表し、 k は0または1～4の整数を示す。

R^3 、 R^{31} 、 R^4 、 R^{41} 、 R^5 、 R^{51} 、 R^6 、 R^{61} および R^7 は、それぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、または C_{1-6} アルコキシ基を示し、 R^3 と R^4 、または R^5 と R^6 は一緒になって飽和環を形成してもよい。

X は、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、またはスルホニル基を示す。

G^1 は、水酸基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、 G^4 で置換されてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を含有する5乃至6員の複素

環基) 複素環基、または C_{3-6} シクロアルキル基を示す。

G^2 は、水酸基、シアノ基、 G^4 で置換されていてもよいアミノ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-6} シクロアルキル基、またはハロゲン原子もしくは C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよい C_{6-10} アリール基を示す。

G^3 は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、または C_{1-6} アルキルスルホニル基を示す。

G^4 は C_{1-6} アルキル基、または C_{1-6} アルコキシ基を示す。

n は0または1を示す。]

で表される化合物、式(1)で表される化合物の塩、またはN-酸化物。

2. R^2 の置換位置がピリジン環上の5位である請求項1記載の化合物。
3. R^1 の置換位置の少なくとも1つがベンゼン環上の2位である請求項1～2のいずれかに記載の化合物。
4. 請求項1～3のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤。
5. 請求項1～3のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する殺虫剤。
6. 請求項1～3のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する殺ダニ剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/006887

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D401/04, A01N43/40, 43/46, C07D405/14, 413/14, 451/06

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D401/04, A01N43/40, 43/46, C07D405/14, 413/14, 451/06

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2005

Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2005 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2005

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS/REGISTRY (STN), JSTPlus (JOIS)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	WO 2002/89803 A1 (Sankyo Co., Ltd.), 14 November, 2002 (14.11.02), Referential example 48, 49 & JP 2003-040773 A	1, 3 2, 4-6
X A	WO 2002/81448 A1 (Sankyo Co., Ltd.), 17 October, 2002 (17.10.02), Referential example 48, 49 & JP 2002-363159 A & EP 1375482 A1 & KR 2003087056 A & AU 2002246336 A1 & US 2004/147555 A1	1, 3 2, 4-6



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 May, 2005 (27.05.05)

Date of mailing of the international search report

21 June, 2005 (21.06.05)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/006887

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP 2003-137865 A (Takeda Chemical Industries, Ltd.), 14 May, 2003 (14.05.03), Example 192 & WO 2001/38325 A1 & JP 2001-226350 A & EP 1228067 A1 & KR 2002049044 A & EP 1228067 B1 & EP 1457490 A1	1 2-6
X A	JP 2000-514041 A (Dr. Reddy's Research Foundation), 24 October, 2000 (24.10.00), Synthesis 9, 25 & WO 97/41120 A1 & AU 9729954 A & US 5801173 A & EP 923580 A1 & US 5919782 A	1 2-6
X A	JP 06-211839 A (STERLING WINTHROP INC.), 02 August, 1994 (02.08.94), Example 2 & EP 605031 A1 & AU 9344972 A & CA 2106728 A & US 5364865 A & AU 664640 B & EP 605031 B1	1, 2 3-6

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl.⁷ C07D401/04, A01N43/40, 43/46, C07D405/14, 413/14, 451/06

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl.⁷ C07D401/04, A01N43/40, 43/46, C07D405/14, 413/14, 451/06

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2005年
日本国実用新案登録公報	1996-2005年
日本国登録実用新案公報	1994-2005年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS/REGISTRY (STN)
JSTPlus (JOIS)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	WO 2002/89803 A1 (三共株式会社) 2002.11.14, 参考例 48, 49 参照 & JP 2003-040773 A	1, 3 2, 4-6
X A	WO 2002/81448 A1 (三共株式会社) 2002.10.17, 参考例 48, 49 参照 & JP 2002-363159 A & EP 1375482 A1 & KR 2003087056 A & AU 2002246336 A1 & US 2004/147555 A1	1, 3 2, 4-6

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

27.05.2005

国際調査報告の発送日

21.6.2005

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

安川 聡

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

4C

3039

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	JP 2003-137865 A (武田薬品工業株式会社) 2003. 05. 14, 実施例 192 参照 & WO 2001/38325 A1 & JP 2001-226350 A & EP 1228067 A1 & KR 2002049044 A & EP 1228067 B1 & EP 1457490 A1	1 2-6
X A	JP 2000-514041 A (Dr. Reddy's Research Foundation) 2000. 10. 24, 合成 9, 25 参照 & WO 97/41120 A1 & AU 9729954 A & US 5801173 A & EP 923580 A1 & US 5919782 A	1 2-6
X A	JP 06-211839 A (STERLING WINTHROP INCORPORATED) 1994. 08. 02, 実施例 No. 2 参照 & EP 605031 A1 & AU 9344972 A & CA 2106728 A & US 5364865 A & AU 664640 B & EP 605031 B1	1, 2 3-6